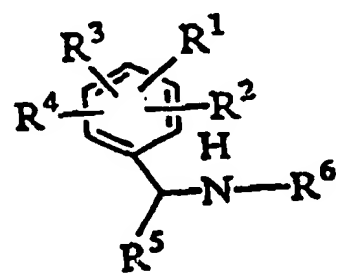


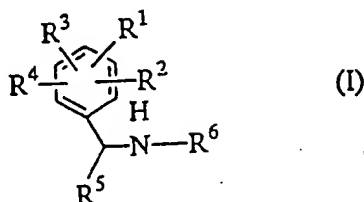


CT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類6 C07C 237/38, 309/45, 311/08, 311/21, 317/32, C07D 257/04, 333/20, 417/10, A61K 31/135, 31/17, 31/27, 31/38, 31/41, 31/425, 31/475</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO98/56757</p> <p>(43) 国際公開日 1998年12月17日(17.12.98)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/02531</p> <p>(22) 国際出願日 1998年6月9日(09.06.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/153837 1997年6月11日(11.06.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 三共株式会社(SANKYO COMPANY, LIMITED)[JP/JP] 〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および</p> <p>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 石原貞夫(ISHIHARA, Sadao)[JP/JP] 斎藤富士夫(SAITO, Fujio)[JP/JP] 増子英一(MASUKO, Hidekazu)[JP/JP] 河野圭太(KONO, Keita)[JP/JP] 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 大野彰夫, 外(OHNO, Akio et al.) 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo, (JP)</p>	<p>(81) 指定国 AU, BR, CA, CN, CZ, HU, ID, IL, KR, MX, NO, NZ, PL, RU, TR, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	
<p>(54) Title: BENZYLAMINE DERIVATIVES</p> <p>(54) 発明の名称 ベンジルアミン類</p> <p>(57) Abstract Benzylamine derivatives represented by general formula (I) or pharmacologically acceptable salts thereof, which have an excellent ilcal bile acid transporter inhibitory activity, wherein R¹ represents substituted C₆₋₁₀ aryl, optionally substituted tetrazolyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, or optionally substituted (C₆₋₁₀ aryl)sulfonylcarbamoylamino; R², R³, and R⁴ each represents hydrogen; R⁵ represents optionally substituted C₆₋₁₀ aryl; and R⁶ represents C₁₋₁₀ alkyl, a group having -W-R⁷, or optionally substituted C₇₋₁₆ aralkyl, provided when R¹ is C₁₋₆ alkylsulfonyl or C₁₋₆ alkylsulfinyl, then R⁶ is not C₁₋₁₀ alkyl.</p> <div style="text-align: center;">  <p>(I)</p> </div>		

本発明は、優れた回腸型胆汁酸トランスポーター阻害作用を有する一般式



[式中、 R^1 ：置換された $C_6 - C_{10}$ アリール基、置換されてもよいテトラゾリル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、置換されてもよい($C_6 - C_{10}$ アリール)スルホニルカルバモイルアミノ基； R^2 、 R^3 および R^4 ：水素原子； R^5 ：置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基； R^6 ： $C_1 - C_{10}$ アルキル基、式 $-W-R^7$ を有する基、置換されてもよい $C_7 - C_{16}$ アラルキル基； R^1 が、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基または $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基のとき、 R^6 は $C_1 - C_{10}$ アルキル基以外の基]を有するベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア
AM	アルメニア	FR	フランス	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AT	オーストリア	GA	ガボン	LS	レソト	SL	シエラ・レオネ
AU	オーストラリア	GB	英国	LT	リトアニア	SN	セネガル
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサウ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR	トルコ
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
BR	ブラジル	HR	クロアチア	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
CA	カナダ	ID	インドネシア	MW	マラウイ	US	米国
CF	中央アフリカ	IE	アイルランド	MX	メキシコ	UZ	ウズベキスタン
CG	コンゴ	IL	イスラエル	NE	ニジェール	VN	ヴェトナム
CH	スイス	IN	インド	NL	オランダ	YU	ユーゴスラヴィア
CI	コートジボアール	IS	アイスランド	NO	ノルウェー	ZW	ジンバブエ
CM	カメルーン	IT	イタリア	NZ	ニュー・ジーランド		
CN	中国	JP	日本	PL	ポーランド		
CU	キューバ	KE	ケニア	PT	ポルトガル		
CY	キプロス	KG	キルギスタン	RO	ルーマニア		
CZ	チェッコ	KP	北朝鮮	RU	ロシア		
DE	ドイツ	KR	韓国	SD	スーダン		
DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	SE	スウェーデン		
EE	エストニア	LC	セントルシア	SG	シンガポール		
ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン				

明細書

ベンジルアミン類

〔技術分野〕

本発明は、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害作用を有するベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩、ベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する組成物、ベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物（特に、高脂血症若しくは動脈硬化症の治療または予防のための組成物）、医薬を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用、高脂血症若しくは動脈硬化症の治療剤または予防剤を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用あるいはベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の薬理的な有効量を温血動物に投与する高脂血症若しくは動脈硬化症の治療方法または予防方法に関する。

〔背景技術〕

高脂血症は虚血性心疾患の三大危険因子の一つであり、とりわけ高い血中コレステロール値を下げることで虚血性心疾患の治療または予防に有用であるということとは広く認められている。現在市販されている高脂血症治療剤としては、例えばHMG-C o A還元酵素阻害剤やイオン交換樹脂が知られており、これらの薬剤は高脂血症や動脈硬化症を治療または予防する目的で用いられている[Am. J. Cardiol., 76, 899-905 (1995)]。

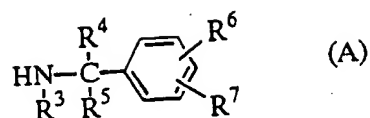
HMG-C o A還元酵素阻害剤は、コレステロール合成阻害作用に加え、肝臓

でのLDL (low density lipoprotein) レセプターを増加させ、血中コレステロールを取り込んで胆汁中に排出促進させる作用を有し、[Science, 232, 34 (1986)]、これらの薬剤の有効性及び安全性は広く認められ多くの患者に使用されている。

また、陰イオン交換樹脂は、胆汁酸を吸着して腸における胆汁酸の再吸収を妨げることにより、肝臓内におけるコレステロールから胆汁酸への変換を促進させ、その結果血中コレステロール濃度を低下させるという作用を有している [N. Engl. J. Med., 302, 1219-1222 (1980)]。そのような陰イオン交換樹脂としては、例えば、コレステラミンを使用する方法が既に実用に供されており、体内に薬剤が吸収されにくいことから、より安全性が求められている小児の高脂血症治療において、第一選択薬とされている。しかしながら、コレステラミンは、1回当たりの服用量が極めて多く、更に服用した際の樹脂のざらざらした感触が口内に残ることから患者が非常に服用しにくいなどの欠点を有している。また、陰イオン交換樹脂は、ある種のビタミン、ミネラル、薬剤等も吸着し排出するため、ビタミンの補給や併用薬剤の投与方法の変更などを考慮しなければならず、問題点が多い。

近年、回腸における胆汁酸再吸収の最初のステップに働く蛋白質、即ち回腸型胆汁酸トランスポーターがクローニングされた [Wong M.H. et al., J. Biol. Chem., 269, 1340-1347 (1994)]。回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害すればコレステラミンと同様な薬理効果を得ることができると考えられており、このような背景から、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤を見出すことが試みられている [Wess G. et al., J. Med. Chem., 37, 873-875 (1994)]。

ところで、特開平2-49771号公報及び特開平2-101064号公報には、殺虫剤として開示されているピラゾールカルボン酸アミド類の中間体として、以下の一般式(A)



[上記式中、 R^3 、 R^4 および R^5 はそれぞれ独立して水素原子、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキル基またはフェニル基を示し、 R^6 および R^7 はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $\text{C}_1 - \text{C}_8$ アルキル基、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキル基、 $\text{C}_2 - \text{C}_4$ アルコキシアルキル基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ハロアルコキシ基、ニトロ基、トリフルオロメチル基、フェニル基、ベンジル基、フェノキシ基、ベンジロキシ基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ基、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ ジアルキルアミノ基、シアノ基、 $\text{C}_2 - \text{C}_8$ アルキルアミノカルボニル基、 $\text{C}_3 - \text{C}_{11}$ ジアルキルアミノカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、トリメチルシリル基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルチオ基、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルスルフィニル基、または $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルスルホニル基を示す。] を有する化合物が開示されている。しかしながら、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤としての用途は知られていない。

また、従来知られているベンジルアミン類として、例えば、特開平 6-49039 号公報にはピリミジン誘導体が、WO 92/00067 にはイミダゾール誘導体が、WO 95/01968 には (1-フェニル-1-ヘテロサイクリル) メチルアミン誘導体が、WO 97/40027 には置換ベンジルアミン類が開示されている。しかしながら、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤としての用途は知られていない。

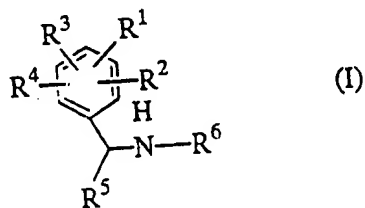
更に、高脂血症または動脈硬化症の治療または予防に有用なベンジルアミン類として、例えば、USP 4485112 には置換ベンゾフラン誘導体が、WO 94/21590 にはフェノキシフェニル酢酸誘導体が、WO 95/35284 には置換フェニル誘導体が開示されている。

【発明の開示】

本発明者等は、一連のベンジルアミン類の合成とそれらの薬理作用について永年に亘り鋭意研究を行った結果、ベンジルアミン類が優れた回腸型胆汁酸トランスポーター阻害作用を有し、高脂血症、動脈硬化症の治療剤または予防剤として有用であることを見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害作用を有するベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩、ベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する組成物、ベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物（特に、高脂血症若しくは動脈硬化症の治療または予防のための組成物）、医薬を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用、回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用、高脂血症若しくは動脈硬化症の治療剤または予防剤を製造するためのベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の使用あるいはベンジルアミン類若しくはその薬理上許容される塩の薬理的な有効量を温血動物に投与する高脂血症若しくは動脈硬化症の治療方法または予防方法を提供する。

本発明の化合物は、一般式（I）を有する。



上記式中、

R^1 は、置換基群 α から選択される基で 1 乃至 3 個置換された $C_0 - C_{10}$ アリール基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、($C_0 - C_6$ シクロアルキル) カルバモイル基、($C_1 - C_6$ アルキル) スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_0 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_0 - C_{10}$ アリールスルホニル基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_0 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイルアミノ基を示し、

R^2 、 R^3 および R^4 は、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基またはジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基を示し、

R^5 は、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_0 - C_{10}$ アリール基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル若しくはオキサゾリル基を示し、

R^6 は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基、式 $-W-R^7$ [式中、 W は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^7 は、置換基群 γ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_0 - C_6$ シクロアルキル基を示す。] を有する基または置換基群 γ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_7 - C_{10}$ アラルキル基を示す。

但し、 R^1 が、 $C_1 - C_{10}$ アルキルスルホニル基または $C_1 - C_{10}$ アルキルスルフィニル基を示す場合、 R^6 は $C_1 - C_{10}$ アルキル基以外の基を示す。

<置換基群 α >

置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_{10}$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_{10}$ アルキルスルホニルアミノ基および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基

<置換基群 β >

$C_1 - C_{10}$ アルキル基、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ基およびハロゲン原子

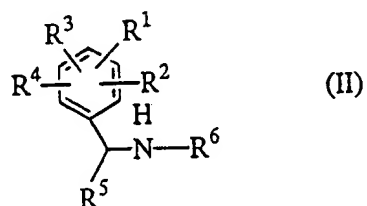
<置換基群 γ >

$C_1 - C_{10}$ アルキル基、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ基、ハロゲン原子および式 $-Z-R^8$ [式中、 Z は、単結合または $C_1 - C_{10}$ アルキレン基を示し、 R^8 は、カルボキシ基、 $C_2 - C_7$ アルコシカルボニル基、カルバモイル基、モノー ($C_1 - C_{10}$ アルキル) カルバモイル基、ジー ($C_1 - C_{10}$ アルキル) カルバモイル基、 $C_1 - C_{10}$ アルキルスルホニル基または水酸基を示す。] を有する基

<置換基群 δ >

$C_1 - C_{10}$ アルキル基、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ基、ハロゲン原子および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよいフェニル基。

更に本発明の回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤は、一般式 (II) を有する化合物またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する。



上記式中、

R^1 は、置換基群 α から選択される基で 1 乃至 3 個置換された $C_6 - C_{10}$ アリール基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、($C_3 - C_6$ シクロアルキル) カルバモイル基、($C_1 - C_6$ アルキル) スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_6 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニル基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_6 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイルアミノ基を示し、

R^2 、 R^3 および R^4 は、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基またはジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基を示し、

R^5 は、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル若しくはオキサゾリル基を示し、

R^6 は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基、式 $-W-R^7$ [式中、W は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^7 は、置換基群 γ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_3 - C_6$ シクロアルキル基を示す。] を有する基または置換基群 γ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_7 - C_{10}$ アラルキル基を示す。

<置換基群 α >

置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基

<置換基群 β >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基およびハロゲン原子

<置換基群 γ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および式 $-Z-R^8$ [式中、 Z は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^8 は、カルボキシ基、 $C_2 - C_7$ アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) カルバモイル基、ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) カルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基または水酸基を示す。] を有する基

<置換基群 δ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよいフェニル基。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 α から選択される基で1乃至3個置換された $C_6 - C_{10}$ アリール基」の $C_6 - C_{10}$ アリール部分は、炭素数6乃至10個の芳香族炭化水素基を示し、例えば、フェニル、インデニル、ナフチル基であり、好適にはフェニル基である。

上記に於て、置換基群 β および δ の定義に於ける「 $C_1 - C_6$ アルキル基」は、炭素数1乃至6個の直鎖または分岐鎖アルキル基を示し、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、ネオペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、

1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル基であり、好適には C_1-C_4 アルキル基であり、更に好適には C_1-C_2 アルキル基であり、特に好適にはメチル基である。

上記に於て、置換基群 β および δ の定義に於ける「 C_1-C_6 アルコキシ基」は、前記 C_1-C_6 アルキル基に酸素原子が結合した基を示し、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ、2-メチルブトキシ、ネオペントキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキシルオキシ、4-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、1-メチルペントキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、2-エチルブトキシ基であり、好適には C_1-C_4 アルコキシ基であり、更に好適には C_1-C_2 アルコキシ基であり、特に好適にはメトキシ基である。

上記に於て、置換基群 β および δ の定義に於ける「ハロゲン原子」は、例えば、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子であり、好適には弗素原子または塩素原子である。

上記に於て、置換基群 α および R^1 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基」は、例えば、1H-テトラゾール-5-イル、1-メチルテトラゾール-5-イル、1-エチルテトラゾール-5-イル、1-メトキシテトラゾール-5-イル、1-エトキシテトラゾール-5-イル、1-フルオロテトラゾール-5-イル、1-クロロテトラゾール-5-イル基である。 R^1 においては、好適には、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 アルコキシ、弗素原子および塩素原子から成る置換基群（以下、置換基群 $\beta 1$ という。）から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基であり、更に好適には、

C₁ - C₂: アルキル、C₁ - C₂: アルコキシ、弗素原子および塩素原子から成る置換基群（以下、置換基群 β 2 という。）から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基であり、より好適には、メチル、メトキシ、弗素原子および塩素原子から成る置換基群（以下、置換基群 β 3 という。）から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基であり、特に好適には 1 H-テトラゾール-5-イル基である。置換基群 α においては、好適には、前記置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基であり、更に好適には、前記置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基であり、特に好適には 1 H-テトラゾール-5-イル基である。

上記に於て、置換基群 α、R¹ および置換基群 γ の R² の定義に於ける「C₁ - C₄: アルキルスルホニル基」は、前記 C₁ - C₄: アルキル基にスルホニル基が結合した基を示し、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル、t-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、イソペンチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、ネオペンチルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、3, 3-ジメチルブチルスルホニル、2, 2-ジメチルブチルスルホニル、1, 1-ジメチルブチルスルホニル、1, 2-ジメチルブチルスルホニル、1, 3-ジメチルブチルスルホニル、2, 3-ジメチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル基である。置換基群 α においては、好適には C₁ - C₄: アルキルスルホニル基であり、更に好適には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニルまたはブチルスルホニル基であり、より好適には、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル基であり、特に好適にはメチルスルホニル基である。R¹ においては、好適には C₁ - C₄: アルキルスルホニル基であり、更に好適には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロ

ビルスルホニルまたはブチルスルホニル基であり、より好適にはメチルスルホニル、エチルスルホニルまたはブチルスルホニル基であり、特に好適には、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル基である。置換基群 γ の R^8 においては、好適には $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル基である。

上記に於て、置換基群 α の定義に於ける「 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニルアミノ基」は、1 個の前記 $C_1 - C_8$ アルキルスルホニル基にアミノ基が結合した基を示し、例えば、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ、イソプロピルスルホニルアミノ、ブチルスルホニルアミノ、イソブチルスルホニルアミノ、s-ブチルスルホニルアミノ、t-ブチルスルホニルアミノ、ペンチルスルホニルアミノ、イソペンチルスルホニルアミノ、2-メチルブチルスルホニルアミノ、ネオペンチルスルホニルアミノ、1-エチルプロピルスルホニルアミノ、ヘキシルスルホニルアミノ、4-メチルペンチルスルホニルアミノ、3-メチルペンチルスルホニルアミノ、2-メチルペンチルスルホニルアミノ、1-メチルペンチルスルホニルアミノ基であり、好適にはメチルスルホニルアミノ基またはエチルスルホニルアミノ基であり、特に好適にはメチルスルホニルアミノ基である。

上記に於て、置換基群 α の定義に於ける「置換基群 β から選択される置換基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基」の $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ部分は、1 個の $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニル基（前記 $C_6 - C_{10}$ アリール基にスルホニル基が結合した基を示し、例えば、フェニルスルホニル、インデニルスルホニル、ナフチルスルホニル基である。）にアミノ基が結合した基を示し、例えば、フェニルスルホニルアミノ、インデニルスルホニルアミノ、ナフチルスルホニルアミノ基であり、好適にはフェニルスルホニルアミノ基である。また、置換基群 β から選択される 1 乃至 3 個の置換基（好適には 1 個である。）は、好適には前記置換基群 β 2 から選択される基である。

そのような「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基」は、好適には前記置換基群 β 2 から選択される基である。

「 $-C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基」は、例えば、フェニルスルホニルアミノ、2-メチルフェニルスルホニルアミノ、3-メチルフェニルスルホニルアミノ、4-メチルフェニルスルホニルアミノ、2-メトキシフェニルスルホニルアミノ、3-メトキシフェニルスルホニルアミノ、4-メトキシフェニルスルホニルアミノ、2-フルオロフェニルスルホニルアミノ、3-フルオロフェニルスルホニルアミノ、4-フルオロフェニルスルホニルアミノ、2-クロロフェニルスルホニルアミノ、3-クロロフェニルスルホニルアミノ、4-クロロフェニルスルホニルアミノ、(インダン-1-イル)スルホニルアミノ、(インダン-2-イル)スルホニルアミノ、(ナフタレン-1-イル)スルホニルアミノ、(ナフタレン-2-イル)スルホニルアミノ基であり、好適には前記置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基であり、特に好適にはフェニルスルホニルアミノ基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 α から選択される基で1乃至3個置換された C_6 、 $-C_{10}$ アリール基」の置換基群 α は、好適には、前記置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 C_1 、 $-C_4$ アルキルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基および前記置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基から成る群（以下、置換基群 α 1という。）から選択される基であり、更に好適には、前記置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基およびフェニルスルホニルアミノ基から成る群から選択される基であり、より好適には、1H-テトラゾール-5-イル基、メチルスルホニル基およびエチルスルホニル基であり、特に好適にはメチルスルホニル基である。

そのような「置換基群 α から選択される基で1乃至3個置換された C_6 、 $-C_{10}$ アリール基」の具体例は、例えば、2-、3-若しくは4-(1H-テトラゾール

ル-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-メチルテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-エチルテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-メトキシテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-エトキシテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテトラゾール-5-イル) フェニル、2-, 3-若しくは4-スルホフェニル、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-プロピルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-イソプロピルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-ブチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-イソブチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-s-ブチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-t-ブチルスルホニルフェニル、2-若しくは4-ペンチルスルホニルフェニル、2-若しくは4-イソペンチルスルホニルフェニル、2-若しくは4-(2-メチルブチルスルホニル) フェニル、2-(1-エチルプロピルスルホニル) フェニル、2-若しくは4-ヘキシルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-(メチルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(エチルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(プロピルスルホニルアミノ) フェニル、2-若しくは4-(イソプロピルスルホニルアミノ) フェニル、2-若しくは4-(ブチルスルホニルアミノ) フェニル、2-若しくは4-(イソブチルスルホニルアミノ) フェニル、2-若しくは4-(s-ブチルスルホニルアミノ) フェニル、2-若しくは4-(t-ブチルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(フェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(2-メチルフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(3-メチルフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(4-メチルフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-, 3-若しくは4-(2-メ

トキシフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(3-メ
トキシフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(4-メ
トキシフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(2-フ
ルオロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(3-フ
ルオロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(4-フ
ルオロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(2-ク
ロロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(3-クロ
ロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2-、3-若しくは4-(4-クロ
ロフェニルスルホニルアミノ) フェニル、2、4-ジ- (メチルスルホニル) フェ
ニル、2、4-ジ- (エチルスルホニル) フェニル、2、4、6-トリ- (メチ
ルスルホニル) フェニル、2-、3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-
イル) インデニル、2-若しくは4-(1-メチルテトラゾール-5-イル) イ
ンデニル、2-スルホインデニル、2-、3-若しくは4-メチルスルホニルイ
ンデニル、2-、3-若しくは4-エチルスルホニルインデニル、2-若しくは
4-プロピルスルホニルインデニル、2-、3-若しくは4-(メチルスルホニ
ルアミノ) インデニル、2-、3-若しくは4-(エチルスルホニルアミノ) イ
ンデニル、3-若しくは4-(フェニルスルホニルアミノ) インデニル、2-、
3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル) ナフチル、2-若しくは4-
-(1-メチルテトラゾール-5-イル) ナフチル、2-スルホナフチル、2-
、3-若しくは4-メチルスルホニルナフチル、2-、3-若しくは4-エチル
スルホニルナフチル、2-若しくは4-プロピルスルホニルナフチル、2-、3-
若しくは4-(メチルスルホニルアミノ) ナフチル、2-、3-若しくは4-
(エチルスルホニルアミノ) ナフチル、3-若しくは4-(フェニルスルホニル
アミノ) ナフチル基であり、好適には、2-、3-若しくは4-(1H-テトラ
ゾール-5-イル) フェニル、2-、3-若しくは4-(1-メチルテトラゾー
ル-5-イル) フェニル、2-、3-若しくは4-(1-メトキシテトラゾール

-5-イル)フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロテトラゾール-5-イル)フェニル、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテトラゾール-5-イル)フェニル、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-プロピルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-ブチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルアミノフェニルまたは2-, 3-若しくは4-フェニルスルホニルアミノフェニル基であり、より好適には、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基であり、特に好適には、2-メチルスルホニルフェニル、3-メチルスルホニルフェニルまたは4-メチルスルホニルフェニル基である。

上記に於て、R¹の定義に於ける「(C₃-C₆シクロアルキル)カルバモイル基」は、C₃-C₆シクロアルキル基(炭素数3乃至6個の飽和環状炭化水素基であり、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル基である。)にカルバモイル基が結合した基を示し、例えば、シクロプロピルカルバモイル、シクロブチルカルバモイル、シクロペンチルカルバモイル、シクロヘキシルカルバモイル基であり、好適にはC₅-C₆シクロアルキルカルバモイル基である。

上記に於て、R¹の定義に於ける「(C₁-C₆アルキル)スルホニルカルバモイル基」は、1個の前記C₁-C₆アルキルスルホニル基にカルバモイル基が結合した基を示し、例えば、メチルスルホニルカルバモイル、エチルスルホニルカルバモイル、プロピルスルホニルカルバモイル、イソプロピルスルホニルカルバモイル、ブチルスルホニルカルバモイル、イソブチルスルホニルカルバモイル、s-ブチルスルホニルカルバモイル、t-ブチルスルホニルカルバモイル、ペンチルスルホニルカルバモイル、イソペンチルスルホニルカルバモイル、2-メチルブチルスルホニルカルバモイル、ネオペンチルスルホニルカルバモイル、1

－エチルプロピルスルホニルカルバモイル、ヘキシルスルホニルカルバモイル、
 4－メチルペンチルスルホニルカルバモイル、3－メチルペンチルスルホニルカルバモイル、2－メチルペンチルスルホニルカルバモイル、1－メチルペンチルスルホニルカルバモイル、3, 3－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、2, 2－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、1, 1－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、1, 2－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、1, 3－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、2, 3－ジメチルブチルスルホニルカルバモイル、2－エチルブチルスルホニルカルバモイル基であり、好適には(C₁－C₄アルキルスルホニル)カルバモイル基であり、特に好適には(C₁－C₂アルキルスルホニル)カルバモイル基である。

上記に於て、R¹の定義に於ける「置換基群δから選択される基で1乃至3個置換されてもよい(C₆－C₁₀アリール)スルホニルカルバモイル基」のC₆－C₁₀アリール)スルホニルカルバモイル部分は、前記C₆－C₁₀アリールスルホニル基にカルバモイル基が結合した基を示し、例えば、フェニルスルホニルカルバモイル、インデニルスルホニルカルバモイル、ナフチルスルホニルカルバモイル基であり、好適にはフェニルスルホニルカルバモイル基である。また、上記(C₆－C₁₀アリール)スルホニルカルバモイル基の置換基群δから選択される1乃至3個の置換基(好適には1個である。)は、前記C₁－C₆アルキル基、前記C₁－C₆アルコキシ基、前記ハロゲン原子または置換基群βから選択される基で1乃至3個(好適には1個である。)置換されてもよいフェニル基であり、好適には、C₁－C₄アルキル基、C₁－C₄アルコキシ基、ハロゲン原子および前記置換基群β₁から選択される基で置換されてもよいフェニル基から成る群(以下、置換基群δ₁という。)から選択される基であり、更に好適には、C₁－C₂アルキル基、C₁－C₂アルコキシ基、フッ素原子、塩素原子および前記置換基群β₂から選択される基で置換されてもよいフェニル基から成る群(以下、置換基群δ₂という。)から選択される基であり、より好適には、メチル、メト

キシ、弗素原子、塩素原子および置換されてもよいフェニル基（該置換基は、 C_1 - C_2 アルキル、メトキシ、弗素原子または塩素原子）から成る置換基群（以下、置換基群 $\delta 3$ という。）から選択される基であり、特に好適には、メチル基、フェニル基およびメチルフェニル基から成る置換基群（以下、置換基群 $\delta 4$ という。）から選択される基である。

そのような「置換基群 δ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい（ C_6 - C_{10} アリール）スルホニルカルバモイル基」は、例えば、フェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-メチルフェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-エチルフェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-メトキシフェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-フルオロフェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-クロロフェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-（2-、3-若しくは4-メチルフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-（2-、3-若しくは4-エチルフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-（2-、3-若しくは4-メトキシフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-（2-、3-若しくは4-フルオロフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル、2-、3-若しくは4-（2-、3-若しくは4-クロロフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル、5-メチルインデン-1-イル、5-メチルインデン-2-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-2-イル基であり、好適には前記置換基群 $\delta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基であり、更に好適には前記置換基群 $\delta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基であり、より好適には前記置換基群 $\delta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基であり、特に好適には前記置換基群 $\delta 4$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリールスルホニル基」の $C_1 - C_{10}$ アリールスルホニル部分は、前記 $C_1 - C_{10}$ アリールスルホニル基と同意義を示し、好適には、フェニルスルホニル基である。また置換基群 β から選択される 1 乃至 3 個の置換基（好適には 1 個である。）は、好適には前記置換基群 $\beta 1$ から選択される基であり、更に好適には前記置換基群 $\beta 2$ から選択される基であり、特に好適には前記置換基群 $\beta 3$ から選択される基である。

そのような「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリールスルホニル基」は、例えば、フェニルスルホニル、2-、3-若しくは 4-メチルフェニルスルホニル、2-、3-若しくは 4-エチルフェニルスルホニル、2-、3-若しくは 4-メトキシフェニルスルホニル、2-、3-若しくは 4-フルオロフェニルスルホニル、2-、3-若しくは 4-クロロフェニルスルホニル、（インデン-1-, 2-若しくは 3-イル）スルホニル、（ナフタレン-2-イル）スルホニル、（ナフタレン-1-若しくは 2-イル）スルホニル基であり、好適には前記置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基であり、更に好適には前記置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基であり、より好適には前記置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基であり、特に好適にはフェニルスルホニル基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「モノ- ($C_1 - C_{10}$ アルキル) アミノスルホニル基」は、モノ- ($C_1 - C_{10}$ アルキル) アミノ基（1 個の前記 $C_1 - C_{10}$ アルキル基にアミノ基が結合した基を示し、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ基である。）にスルホニル基が結合した基を示し、例えば、メチルアミノスルホニル、エチルアミノスルホニル、プロピルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、

ホニル、ブチルアミノスルホニル、イソブチルアミノスルホニル、s-ブチルアミノスルホニル、t-ブチルアミノスルホニル、ペンチルアミノスルホニル、ヘキシルアミノスルホニル基であり、好適にはメチルアミノスルホニル基またはエチルアミノスルホニル基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「ジ- $(C_1-C_6$ アルキル)アミノスルホニル基」は、ジ- $(C_1-C_6$ アルキル)アミノ基（同一または異なる2個の前記 C_1-C_6 アルキル基がアミノ基に結合した基を示し、例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、N-メチル-N-プロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジイソブチルアミノ、ジ-s-ブチルアミノ、ジ-t-ブチルアミノ、ジペンチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、ジヘキシルアミノ基である。）にスルホニル基が結合した基を示し、例えば、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、N-エチル-N-メチルアミノスルホニル、ジプロピルアミノスルホニル、ジイソプロピルアミノスルホニル、N-メチル-N-プロピルアミノスルホニル、ジブチルアミノスルホニル、ジイソブチルアミノスルホニル、ジ-s-ブチルアミノスルホニル、ジ-t-ブチルアミノスルホニル、ジペンチルアミノスルホニル、N-エチル-N-プロピルアミノスルホニル、ジヘキシルアミノスルホニル基であり、好適にはジメチルアミノスルホニル基またはジエチルアミノスルホニル基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基」は、前記 C_1-C_6 アルキル基にスルフィニル基が結合した基を示し、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル、t-ブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、イソペンチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、ネオペンチルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィ

ニル、3-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、3, 3-ジメチルブチルスルフィニル、2, 2-ジメチルブチルスルフィニル、1, 1-ジメチルブチルスルフィニル、1, 2-ジメチルブチルスルフィニル、1, 3-ジメチルブチルスルフィニル、2, 3-ジメチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル基であり、好適には $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル基であり、特に好適には $C_1 - C_2$ アルキルスルフィニル基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基」の $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ部分は、前記 $C_6 - C_{10}$ アリール基にカルボニルアミノ基が結合した基を示し、例えば、フェニルカルボニルアミノ、インデニルカルボニルアミノ、ナフチルカルボニルアミノ基であり、好適にはフェニルカルボニルアミノ基である。また、置換基群 β から選択される1乃至3個の置換基（好適には、1個である。）は、好適には前記置換基群 β 2から選択される基であり、特に好適には前記置換基群 β 3から選択される基である。

そのような「置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基」は、例えば、フェニルカルボニルアミノ、2-, 3-若しくは4-メチルフェニルカルボニルアミノ、2-, 3-若しくは4-エチルフェニルカルボニルアミノ、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニルカルボニルアミノ、2-, 3-若しくは4-フルオロフェニルカルボニルアミノ、2-, 3-若しくは4-フルオロフェニルカルボニルアミノ、（インデン-1-イル）カルボニルアミノ、（インデン-2-イル）カルボニルアミノ、（ナフタレン-1-イル）カルボニルアミノ、（ナフタレン-2-イル）カルボニルアミノ基であり、好適には前記置換基群 β 2から選択される基で置換されてよいフェニルカルボニルアミノ基であり、特に好適には前記置換基群 β 3から選択される基で置換されてよいフェニルカルボニルアミノ基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基」は、例えば、(1H-テトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ、(1-メチルテトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ、(1-エチルテトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ、(1-メトキシテトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ、(1-フルオロテトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ、(1-クロロテトラゾール-5-イル)カルボニルアミノ基であり、好適には前記置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基であり、特に好適には前記置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基である。

上記に於て、 R^1 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい (C_6H_5 アリール) スルホニルカルバモイルアミノ基」の (C_6H_5 アリール) スルホニルカルバモイルアミノ部分は、前記 (C_6H_5 アリール) スルホニルカルバモイル基にアミノ基が結合した基を示し、例えば、フェニルスルホニルカルバモイルアミノ、インデニルスルホニルカルバモイルアミノ、ナフチルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、好適にはフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基である。また、置換基群 β から選択される 1 乃至 3 個の置換基 (好適には 1 個である) は、好適には前記置換基群 β 1 から選択される基であり、更に好適には前記置換基群 β 2 から選択される基であり、より好適には $C_1 - C_2$ アルキル、メトキシ、弗素原子または塩素原子であり、特に好適にはメチル基である。

そのような「置換基群βから選択される基で1乃至3個置換されてもよい(C₆ - C₁₀アリール)スルホニルカルバモイルアミノ基」は、例えば、フェニルスルホニルカルバモイルアミノ、2-, 3-若しくは4-メチルフェニルスルホニルカルバモイルアミノ、2-, 3-若しくは4-エチルフェニルスルホニルカルバモイルアミノ、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニルスルホニルカルバモ

イルアミノ、2-、3-若しくは4-エトキシフェニルスルホニルカルバモイルアミノ、2-、3-若しくは4-フルオロフェニルスルホニルカルバモイルアミノ、2-、3-若しくは4-クロロフェニルスルホニルカルバモイルアミノ、インデニルスルホニルカルバモイルアミノ、ナフチルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、好適には前記置換基群 β 1から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、更に好適には前記置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、より好適には C_1-C_2 アルキル、メトキシ、弗素原子または塩素原子で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、更により好適には、メチル基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、特に好適にはトシルカルバモイルアミノ基である。

上記に於て、 R^2 、 R^3 、 R^4 および置換基群 γ の定義に於ける「 C_1-C_6 アルキル基」は、前記 C_1-C_6 アルキル基と同意義を示し、 R^2 、 R^3 および R^4 においては、好適には C_1-C_2 アルキル基であり、特に好適にはメチル基であり、置換基群 γ においては、好適には C_1-C_2 アルキル基または t -ブチル基であり、更に好適にはメチル基または t -ブチル基であり、特に好適にはメチル基である。

上記に於て、 R^2 、 R^3 、 R^4 および置換基群 γ の定義に於ける「 C_1-C_6 アルコキシ基」は、前記 C_1-C_6 アルコキシ基と同意義を示し、好適には C_1-C_2 アルコキシ基であり、特に好適にはメトキシ基である。

上記に於て、 R^2 、 R^3 、 R^4 および置換基群 γ の定義に於ける「ハロゲン原子」は、前記ハロゲン原子と同意義を示し、 R^2 においては、好適には弗素原子または塩素原子であり、特に好適には弗素原子である。 R^3 および R^4 においては、好適には弗素原子または塩素原子である。

上記に於て、 R^2 、 R^3 および R^4 の定義に於ける「モノ- (C_1-C_6 アルキル) アミノ基」は、前記モノ- (C_1-C_6 アルキル) アミノ基と同意義を示

し、好適にはモノー ($C_1 - C_2$ アルキル) アミノ基である。

上記に於て、 R^2 、 R^3 および R^4 の定義に於ける「ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基」は、前記ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基と同意義を示し、好適にはジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基である。

上記に於て、 R^5 の定義に於ける「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基」の $C_6 - C_{10}$ アリール部分は、前記 $C_6 - C_{10}$ アリール基と同意義を示し、好適にはフェニルまたはナフチル基であり、特に好適にはフェニル基である。また、置換基群 β から選択される 1 乃至 3 個の置換基 (好適には 1 個である。) は、好適には前記置換基群 $\beta 1$ から選択される基であり、更に好適には前記置換基群 $\beta 2$ から選択される基であり、より好適には前記置換基群 $\beta 3$ から選択される基であり、特に好適にはメトキシ基である。

そのような「置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基」は、例えば、フェニル、2-, 3-若しくは 4-メチルフェニル、2-, 3-若しくは 4-エチルフェニル、2-, 3-若しくは 4-メトキシフェニル、2-, 3-若しくは 4-クロロフェニル、2-, 3-若しくは 4-フルオロフェニル、4-メチル-2-メトキシフェニル、6-フルオロ-4-メチル-2-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニル、2, 3, 4-トリメトキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル、インデン-2-若しくは 3-イル、5-メチルインデン-2-イル、5-メチルインデン-3-イル、ナフタレン-1-若しくは 2-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-2-イル基であり、好適には前記置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルまたはナフチル基であり、更に好適には前記置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基であり、より好適には前記置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基

であり、更により好適にはフェニル、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニルまたは3, 4, 5-トリメトキシフェニル基であり、更によりまた好適には、フェニルまたは2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル基であり、特に好適にはフェニル基である。

上記に於て、R⁶の定義に於ける「置換基群βから選択される基で1乃至3個置換されてもよく、ベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1, 1-ジオキチエニル、チアゾリル若しくはオキサゾリル基」の置換基群βから選択される1乃至3個の置換基（好適には、1個である。）は、好適には前記置換基群β 1から選択される基であり、更に好適には前記置換基群β 2から選択される基であり、特に好適には前記置換基群β 3から選択される基である。

そのような「置換基群βから選択される基で1乃至3個置換されてもよく、ベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル若しくは1, 1-ジオキチエニル基」は、例えば、チオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メチルチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-エチルチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メトキシチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-フルオロチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-クロロチオフエン-2-イル、チオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メチルチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-エチルチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メトキシチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-フルオロチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-クロロチオフエン-3-イル、ピロール-1-イル、ピロール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-メチルピロール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-エチルピロール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-メトキシピロール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-フルオロピロール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-クロロピロール-2-イル、ピロール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-メチ

ルピロール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-エチルピロール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-メトキシピロール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-フルオロピロール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-クロロピロール-3-イル、1, 1-ジオキソチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メチル-1, 1-ジオキソチオフエン-2-イル、1, 1-ジオキソチオフエン-3-イル、3-, 4-若しくは5-メチル-1, 1-ジオキソチオフエン-3-イル、チアゾール-5-イル、2-若しくは4-メチルチアゾール-5-イル、オキサゾール-5-イル、2-若しくは4-メチルオキサゾール-5-イル、ベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メチルベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メトキシベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-フルオロベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-若しくは5-クロロベンゾチオフエン-2-イル、ベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メチルベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メトキシベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-フルオロベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-若しくは5-クロロベンゾチオフエン-3-イル、インドール-1-イル、インドール-2-イル、1-, 3-, 4-若しくは5-メチルインドール-2-イル、3-, 4-若しくは5-メトキシインドール-2-イル、3-, 4-若しくは5-フルオロインドール-2-イル、3-, 4-若しくは5-クロロインドール-2-イル、インドール-3-イル、1-, 2-, 4-若しくは5-メチルインドール-3-イル、2-, 4-若しくは5-メトキシインドール-3-イル、2-, 4-若しくは5-フルオロインドール-3-イル、2-, 4-若しくは5-クロロインドール-3-イル、1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-, 5-, 6-若しくは7-メチル-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-, 5-, 6-若しくは7-メトキシ-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-2-イル、3-, 4-, 5-, 6-若しくは7-フルオロ-1, 1-ジオキソベンゾ

チオフエン-2-イル、3-, 4-, 5-, 6-若しくは7-クロロ-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-2-イル、1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-, 5-, 6-若しくは7-メチル-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-, 5-, 6-若しくは7-メトキシ-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-, 5-, 6-若しくは7-フルオロ-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イル、2-, 4-, 5-, 6-若しくは7-クロロ-1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イル、ベンゾチアゾール-2-イル、4-, 5-, 6-若しくは7-メチルベンゾチアゾール-2-イル、ベンゾオキサゾール-2-イル、4-, 5-, 6-若しくは7-メチルベンゾオキサゾール-2-イル基であり、好適には前記置換基群β1から選択される基で置換されてもよい、チエニル、1, 1-ジオキソチエニル、チアゾリル、ベンゾチエニル、1, 1-ジオキソベンゾチエニルまたはベンゾチアゾリル基であり、更に好適には前記置換基群β2から選択される基で置換されてもよい、チエニル、チアゾリル、ベンゾチエニルまたは1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であり、より好適には前記置換基群β3から選択される基で置換されてもよい、ベンゾチエニル基または1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であり、特に好適には1, 1-ジオキソベンゾチオフエン-3-イルである。

上記に於て、R⁶の定義に於ける「C₁-C₁₀アルキル基」は、炭素数1乃至10個の直鎖または分岐鎖の炭化水素基であり、例えば、前記C₁-C₁₀アルキル、ヘプチル、1-メチルヘキシル、2-メチルヘキシル、3-メチルヘキシル、4-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、1-プロピルブチル、1-エチルペンチル、2-エチルペンチル、3-エチルペンチル、4-エチルペンチル、4, 4-ジメチルペンチル、オクチル、1-メチルヘプチル、2-メチルヘプチル、3-メチルヘプチル、4-メチルヘプチル、5-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル、1-プロピルペンチル、2-プロピルペンチル、3-プロピルペンチル、4-プロピルペンチル、1-エチルヘキシル、2-エチルヘキシル、3-エ

チルヘキシル、4-エチルヘキシル、5-エチルヘキシル、5, 5-ジメチルヘキシル、ノニル、3-メチルオクチル、4-メチルオクチル、5-メチルオクチル、6-メチルオクチル、1-プロピルヘキシル、2-プロピルヘキシル、3-プロピルヘキシル、4-プロピルヘキシル、5-プロピルヘキシル、2-エチルヘプチル、6, 6-ジメチルヘプチル、1-ブチルペンチル、2-ブチルペンチル、3-ブチルペンチル、4-ブチルペンチル、1-ブチルヘキシル、2-ブチルヘキシル、3-ブチルヘキシル、4-ブチルヘキシル、5-ブチルヘキシル、デシル、1-メチルノニル、3-メチルノニル、8-メチルノニル、3-エチルオクチル、3, 7-ジメチルオクチル、7, 7-ジメチルオクチル基であり、好適には C_3 - C_8 アルキル基であり、更に好適には、イソプロピル、ブチル、t-ブチル、ネオペンチル、1-エチルペンチルまたは2-エチルヘキシル基であり、特に好適には1-エチルペンチル基である。

上記に於て、WおよびZの定義に於ける「 C_1 - C_8 アルキレン基」は、例えば、メチレン、メチルメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、1-メチルエチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、3-メチルトリメチレン、1-メチルプロピレン、1, 1-ジメチルエチレン、ペンタメチレン、1-メチルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、3-メチルテトラメチレン、4-メチルテトラメチレン、1, 1-ジメチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、3, 3-ジメチルトリメチレン、ヘキサメチレン、1-メチルペンタメチレン、2-メチルペンタメチレン、3-メチルペンタメチレン、4-メチルペンタメチレン、5-メチルペンタメチレン、1, 1-ジメチルテトラメチレン、2, 2-ジメチルテトラメチレン、3, 3-ジメチルテトラメチレン、4, 4-ジメチルテトラメチレン基であり、好適には C_1 - C_8 アルキレン基であり、特に好適にはメチレン基である。

上記に於て、 R^7 の定義に於ける「置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい C_6 - C_{10} シクロアルキル基」の

C₃ - C₆ シクロアルキル部分は前記 C₃ - C₆ シクロアルキル基と同意義を示し、ベンゼン環と縮合してもよい。そのような C₃ - C₆ シクロアルキル基としては、例えば、前記 C₃ - C₆ シクロアルキル、インダニル、ベンゾシクロヘキシル基であり、好適には、ベンゼン環と縮合してもよい C₆ - C₆ シクロアルキル基であり、特に好適にはシクロヘキシル基である。

また、置換基群 γ から選択される 1 乃至 3 個の置換基（好適には 1 個である。）は、前記 C₁ - C₆ アルキル基、前記 C₁ - C₆ アルコキシ基、前記ハロゲン原子および式 -Z-R⁸（式中、Z は、単結合または前記 C₁ - C₆ アルキレン基であり、R⁸ は、カルボキシ基、C₂ - C₇ アルコキシカルボニル基（前記 C₁ - C₆ アルコキシ基にカルボニル基が結合した基を示し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、ペントキシカルボニル、イソペントキシカルボニル、2-メチルブトキシカルボニル、ネオペントキシカルボニル、1-エチルプロポキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、4-メチルペントキシカルボニル、3-メチルペントキシカルボニル、2-メチルペントキシカルボニル、1-メチルペントキシカルボニル、3, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 1-ジメチルブトキシカルボニル、1, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2-エチルブトキシカルボニル基であり、好適には C₂ - C₃ アルコキシカルボニル基であり、特に好適にはメトキシカルボニル基である。）、カルバモイル基、モノ-（C₁ - C₆ アルキル）カルバモイル基（カルバモイル基に 1 個の前記 C₁ - C₆ アルキル基が結合した基を示し、例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、イソプロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、イソブチルカルバモイル、s-ブチルカルバモイル、t-ブチルカルバモイル、ペンチルカルバモイル、イソペンチルカルバモイル、

ルカルバモイル、2-メチルブチルカルバモイル、ネオペンチルカルバモイル、1-エチルプロピルカルバモイル、ヘキシルカルバモイル基であり、好適にはC₁-C₂アルキルカルバモイル基である。)、ジ-(C₁-C₆アルキル)カルバモイル基[カルバモイル基に同一または異なる2個の前記C₁-C₆アルキル基が結合した基を示し、例えば、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル、N-エチル-N-メチルカルバモイル、ジプロピルカルバモイル、ジイソプロピルカルバモイル、N-メチル-N-プロピルカルバモイル、ジブチルカルバモイル、ジイソブチルカルバモイル、ジ-s-ブチルカルバモイル、ジ-t-ブチルカルバモイル、N-ブチル-N-メチルカルバモイル、ジペンチルカルバモイル、N-エチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-エチルカルバモイル、ジヘキシルカルバモイル、N-ブチル-N-プロピルカルバモイル基であり、好適にはジ-(C₁-C₂アルキル)カルバモイル基であり、特に好適にはジメチルカルバモイル基である。]、前記C₁-C₆アルキルスルホニル基または水酸基である。)を有する基から成る。好適には、C₁-C₂アルキル基、t-ブチル基、C₁-C₂アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および式-Z-R⁸[式中、Zは、単結合またはC₁-C₂アルキレン基であり、R⁸は、カルボキシ基、C₂-C₃アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、モノ-(C₁-C₂アルキル)カルバモイル基、ジ-(C₁-C₂アルキル)カルバモイル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基または水酸基である。]を有する基から成る置換基群(以下、置換基群γ1という。)から選択される基であり、更に好適には、メチル基、t-ブチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、ジメチルカルバモイル基およびヒドロキシメチル基から成る置換基群(以下、置換基群γ2という。)から選択される基であり、特に好適には、メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子から成る置換基群(以下、置換基群γ3という。)から選択される基である。

そのような「置換基群γから選択される基で1乃至3個置換されてもよくベン

ゼン環と縮合してもよいC₇ - C₁₀シクロアルキル基」は、例えば、シクロペンチル、シクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-メチルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-エチルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-*t*-ブチルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-メトキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-フルオロシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-クロロシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-カルボキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-メトキシカルボニルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-カルバモイルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-メチルカルバモイルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-ジメチルカルバモイルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-ヒドロキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-ヒドロキシメチルシクロヘキシル、インダン-1-イル、インダン-2-イル基であり、好適には前記置換基群 γ 1から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよいC₇ - C₁₀シクロアルキル基であり、更に好適には前記置換基群 γ 2から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよいC₇ - C₁₀シクロアルキル基であり、より好適には前記置換基群 γ 3から選択される基で置換されてもよいシクロヘキシル基であり、特に好適にはシクロヘキシル基である。

上記に於て、R⁶の定義に於ける「置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよいC₇ - C₁₀アラルキル基」のC₇ - C₁₀アラルキル部分は、前記C₇ - C₁₀アリアル基に前記C₁ - C₆アルキル基が結合した基を示し、例えば、ベンジル、ナフチルメチル、インデニルメチル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-ナフチルエチル、2-ナフチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-ナフチルプロピル、2-ナフチルプロピル、3-ナフチルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-ナフチルブチル、2-ナフチルブチル、3-ナフチルブチル、4-ナフチルブチル、1-フェニル

ペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-ナフチルペンチル、2-ナフチルペンチル、3-ナフチルペンチル、4-ナフチルペンチル、5-ナフチルペンチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-ナフチルヘキシル、2-ナフチルヘキシル、3-ナフチルヘキシル、4-ナフチルヘキシル、5-ナフチルヘキシル、6-ナフチルヘキシル基であり得、好適にはアリール部分がフェニル基でありアルキル部分がC₁-C₄アルキル基であるアラルキル基であり、更に好適にはベンジル、1-フェニルエチルまたは2-フェニルエチル基であり、特に好適には1-フェニルエチル基である。

また、置換基群 γ から選択される1乃至3個の置換基（好適には1個である。）は、前記置換基群 γ と同意義を示し、好適には前記置換基群 γ 1から選択される基であり、更に好適には前記置換基群 γ 2から選択される基であり、特に好適には前記置換基群 γ 3から選択される基である。

そのような「置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよいC₇-C₁₀アラルキル基」は、例えば、ベンジル、2-、3-若しくは4-メチルベンジル、2-、3-若しくは4-エチルベンジル、2-、3-若しくは4-メトキシベンジル、2-、3-若しくは4-フルオロベンジル、2-、3-若しくは4-クロロベンジル、2-、3-若しくは4-カルボキシベンジル、2-、3-若しくは4-カルバモイルベンジル、2-、3-若しくは4-ジメチルカルバモイルベンジル、2-、3-若しくは4-ヒドロキシベンジル、2-、3-若しくは4-ヒドロキシメチルベンジル、1-若しくは2-フェニルエチル、1-若しくは2-(2-、3-若しくは4-メチルフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-、3-若しくは4-エチルフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-、3-若しくは4-メトキシフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-、3-若しくは4-フルオロフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-、3-若しくは4-

4-クロロフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-クロロフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-ブロモフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-カルボキシフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-カルバモイルフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-ジメチルカルバモイルフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-ヒドロキシフェニル)エチル、1-若しくは2-(2-, 3-若しくは4-ヒドロキシメチルフェニル)エチル、1-若しくは2-(ナフタレン-1-イル)エチル、1-若しくは2-(ナフタレン-2-イル)エチル基であり、好適には、前記置換基群 γ 1から選択される基で置換されてもよくアリール部分がフェニル基でありアルキル部分がC₁-C₄アルキル基であるアラルキル基であり、更に好適には、前記置換基群 γ 2から選択される基で置換されてもよくアリール部分がフェニル基でありアルキル部分がC₁-C₄アルキル基であるアラルキル基であり、より好適には、前記置換基群 γ 3から選択される基で置換されてもよい、ベンジル、1-フェニルエチルまたは2-フェニルエチル基であり、特に好適には1-フェニルエチルである。

本発明の化合物(I)または(II)のうち、アミノ基等の塩基性基を有する化合物は、必要に応じて常法によって酸と処理することにより、薬理上許容される塩にすることができる。そのような塩としては、弗化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、沃化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩；硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような弗素で置換されてもよいC₁-C₆アルカンスルホン酸塩；ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなC₆-C₁₀アリールスルホン酸塩等のスルホン酸塩；フマル酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩等のようなカルボン酸塩；またはグルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩；を挙げることができ、

好適には、ハロゲン化水素酸塩、 $C_1 - C_6$ アルカンスルホン酸塩またはカルボン酸塩（特に好適には、塩酸塩、メタンスルホン酸塩、フマル酸塩、シュウ酸塩またはマレイン酸塩である。）である。

また、本発明の化合物（I）または（II）のうち、カルボキシ基等の酸性基を有する化合物は、必要に応じて常法によって塩基と処理することにより、薬理上許容される塩にすることができる。そのような塩としては、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩等の金属塩；アルミニウム塩、鉄塩等の金属塩；アンモニウム塩、グルコサミン塩、フェニルグリシンアルキルエステル塩、エチレンジアミン塩、N-メチルグルカミン塩、グアニジン塩、ジエチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩のような有機塩基塩；を挙げることができ、好適にはアルカリ金属塩である。

本発明の化合物（I）または（II）あるいはそれらの薬理上許容される塩は、大気中に放置したり、または再結晶することにより、水分を吸収し、吸着水が付いたり、水和物となる場合があり、そのようなものも本発明に包含される。

本発明の化合物（I）または（II）あるいはそれらの薬理上許容される塩は、他のある種の溶媒を吸収し、溶媒和物となる場合があり、そのようなものも本発明に包含される。

本発明の化合物（I）または（II）あるいはそれらの薬理上許容される塩は、分子内に不斉炭素原子を有する場合があり、R配位、S配位である立体異性体が存在する場合があるが、その各々、或はそれらの任意の割合の化合物のいずれも本発明に包含される。そのような立体異性体は、光学分割された原料化合物を用いて化合物（I）若しくは（II）を合成するかまたは合成した化合物（I）若しくは（II）を所望により通常の光学分割または分離法を用いて光学分割することができる。

また、本発明の化合物（I）または（II）あるいはそれらの薬理上許容され

る塩は、 R^6 が式 $-W-R^7$ を有する基である場合、幾何異性体が存在するが、本発明は、かかる幾何異性体を包括し、好適には、トランス異性体を挙げることができる。

また本発明においては、生体内において代謝され本発明の一般式 (I) または (II) を有するベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩に変換される化合物、いわゆるプロドラッグも全て含まれる。

また、本発明の、一般式 (I) を有する化合物または胆汁酸トランスポーター阻害剤の有効成分として含有される一般式 (II) を有する化合物において、好適には、下記に示す化合物を挙げるができる。

(1) R^1 が、置換基群 $\alpha 1$ から選択される基で置換されたフェニル基、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C_6 - C_8 シクロアルキル) カルバモイル基、(C_1 - C_4 アルキル) スルホニルカルバモイル基、置換基群 $\delta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、スルホ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル基、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基である化合物。

<置換基群 $\alpha 1$ >

置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基および置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基

<置換基群 $\beta 1$ >

C₁ - C₄ アルキル基、C₁ - C₄ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子
<置換基群 β 2>

C₁ - C₂ アルキル基、C₁ - C₂ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子
<置換基群 δ 1>

C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、ハロゲン原子および置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニル基

(2) R¹ が、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メチルテトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メトキシテトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロテトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-プロピルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-ブチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルアミノフェニル基、2-, 3-若しくは4-フェニルスルホニルアミノフェニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C₁ - C₂ アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、C₁ - C₄ アルキルスルホニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、C₁ - C₂ アルキルスルフィニル基、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基である化合物。

<置換基群 β 2>

C₁ - C₂ アルキル基、C₁ - C₂ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子
<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\delta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基

(3) R^1 が、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 $\delta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基または置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基（該置換基は、 $C_1 - C_2$ アルキル、メトキシ、弗素または塩素）である化合物。

<置換基群 $\beta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\beta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\delta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子および $C_1 - C_2$ アルキル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されてもよいフェニル基

(4) R^1 が、2-メチルスルホニルフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 $\delta 4$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ブチルスルホニル基、フェニルスルホニル基またはメチルで置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基である化合物。

<置換基群 $\beta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\delta 4$ >

メチル基、フェニル基およびメチルフェニル基

(5) R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基またはトシルカルバモイルアミノ基である化合物。

(6) R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基である化合物。

(7) R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、 C_1-C_2 アルキル基、 C_1-C_2 アルコキシ基、水酸基、弗素原子、塩素原子、アミノ基、モノ- (C_1-C_2 アルキル) アミノ基またはジ- (C_1-C_2 アルキル) アミノ基である化合物。

(8) R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、水酸基、弗素原子または塩素原子である化合物。

(9) R^2 が水素原子、メトキシ基または弗素原子であり、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物。

(10) R^2 、 R^3 および R^4 が、水素原子である化合物。

(11) R^5 が、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、ナフチル、チエニル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル、ベンゾチエニル、1,1-ジオキソベンゾチエニルまたはベンゾチアゾリル基である化合物。

<置換基群 $\beta 1$ >

C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

(12) R^5 が、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、チエニル、チアゾリル、ベンゾチエニルまたは1,1-ジオキソベンゾチエニル基である化合物。

<置換基群 $\beta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

(13) R^6 が、置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基、ベンゾチエニル基または 1, 1-ジオキソベンゾチエニル基である化合物。

<置換基群 $\beta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

(14) R^6 が、フェニル、2-, 3-若しくは 4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニルまたは 3, 4, 5-トリメトキシフェニルまたは 1, 1-ジオキソベンゾチオフェン-3-イル基である化合物。

(15) R^6 が、フェニルまたは 2-, 3-若しくは 4-メトキシフェニル基である化合物。

(16) R^6 が、フェニル基である化合物。

(17) R^6 が、 $C_3 - C_8$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ [式中、W は、単結合または $C_1 - C_2$ アルキレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_6 - C_{10}$ シクロアルキル基である。] を有する基または置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基 (アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が $C_1 - C_4$ アルキル基である。) である化合物。

<置換基群 $\gamma 1$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 t -ブチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および式 $-Z-R^8$ [式中、Z は、単結合または $C_1 - C_2$ アルキレン基であり、 R^8 は、カルボキシ、 $C_2 - C_3$ アルコキシカルボニル、カルバモイル、モノ- ($C_1 - C_2$ アルキル) カルバモイル、ジ- ($C_1 - C_2$ アルキル) カルバモイル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニルまたは水酸基] を有する基

(18) R^6 が、 $C_3 - C_8$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ を有する基 [式中、W は、単結合またはメチレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 2$ から選択される基

で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい C_6 - C_6 シクロアルキル基である。] または置換基群 γ 2から選択される基で置換されてもよいアラルキル基(アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が C_1 - C_4 アルキル基である。)である化合物。

<置換基群 γ 2>

メチル基、 t -ブチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、ジメチルカルバモイル基およびヒドロキシメチル基

(19) R^6 が、イソプロピル基、ブチル基、 t -ブチル基、ネオペンチル基、1-エチルペンチル基、2-エチルヘキシル基または置換基群 γ 3から選択される基で置換されてもよい、シクロヘキシル、ベンジル、1-フェニルエチル若しくは2-フェニルエチル基である化合物。

<置換基群 γ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

(20) R^6 が、1-エチルペンチル基、シクロヘキシル基または1-フェニルエチル基である化合物。

(21) R^6 が、1-エチルペンチル基または1-フェニルエチル基である化合物。

また、(1) - (6)、(7) - (10)、(11) - (16) および(17) - (21) から成る群から任意に選択されるものを組み合わせたものも好適であり、例えば、以下のものを挙げることができる。

(22) R^1 が、置換基群 α 1から選択される基で置換されたフェニル基、置換基群 β 1から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C_6 - C_6 シクロアルキル)カルバモイル基、(C_1 - C_4 アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 1から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、スルホ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、置換基群 β 1から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、メチルアミノスルホ

ニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル基、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、

R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、水酸基、弗素原子、塩素原子、アミノ基、モノー($C_1 - C_2$ アルキル)アミノ基またはジー($C_1 - C_2$ アルキル)アミノ基であり、

R^5 が、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、ナフチル、チエニル、チアゾリル、1, 1-ジオキソチエニル、ベンゾチエニル、1, 1-ジオキソベンゾチエニルまたはベンゾチアゾリル基であり、

R^6 が、 $C_3 - C_8$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ [式中、Wは、単結合または $C_1 - C_2$ アルキレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_5 - C_6$ シクロアルキル基である。]を有する基または置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基(アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が $C_1 - C_4$ アルキル基である。)である化合物。

<置換基群 $\alpha 1$ >

置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基および置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基

<置換基群 $\beta 1$ >

$C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\beta 2$ >

C₁ - C₂ アルキル基、C₁ - C₂ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 1>

C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、ハロゲン原子および置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニル基

<置換基群 γ 1>

C₁ - C₂ アルキル基、t-ブチル基、C₁ - C₂ アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および式 -Z-R⁸ [式中、Z は、単結合または C₁ - C₂ アルキレン基であり、R⁸ は、カルボキシ、C₂ - C₃ アルコシカルボニル、カルバモイル、モノ- (C₁ - C₂ アルキル) カルバモイル、ジ- (C₁ - C₂ アルキル) カルバモイル、C₁ - C₄ アルキルスルホニルまたは水酸基] を有する基

(23) R¹ が、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メチルテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メトキシテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-プロピルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-ブチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルアミノフェニル基、2-, 3-若しくは4-フェニルスルホニルアミノフェニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C₁ - C₂ アルキル) スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、C₁ - C₄ アルキルスルホニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、C₁ - C₂ アルキルスルフィニル基、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β 2 から選択される基

で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、

R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、水酸基、弗素原子または塩素原子であり、

R^5 が、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、チエニル、チアゾリル、ベンゾチエニルまたは 1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であり、

R^6 が、 $C_3 - C_8$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ を有する基〔式中、 W は、単結合またはメチレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_6 - C_{10}$ シクロアルキル基である。〕または置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基（アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が $C_1 - C_4$ アルキル基である。）である化合物。

<置換基群 $\beta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\beta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 $\delta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基

<置換基群 $\gamma 2$ >

メチル基、*t*-ブチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、ジメチルカルバモイル基およびヒドロキシメチル基

(24) R^1 が、2-, 3-若しくは 4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは 4-メチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは 4-エチルスルホニルフェニル基、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 $\delta 3$ から選択される基で置換されても

よいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基または置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基（該置換基は、 $C_1 - C_2$ アルキル、メトキシ、弗素または塩素）であり、

R^2 が水素原子、メトキシ基または弗素原子であり、

R^3 および R^4 が水素原子であり、

R^5 が、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよいフェニル基、ベンゾチエニル基または 1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であり、

R^6 が、イソプロピル基、ブチル基、t-ブチル基、ネオペンチル基、1-エチルペンチル基、2-エチルヘキシル基または置換基群 γ 3 から選択される基で置換されてもよい、シクロヘキシル、ベンジル、1-フェニルエチル若しくは 2-フェニルエチル基である化合物。

<置換基群 β 2>

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子および $C_1 - C_2$ アルキル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されてもよいフェニル基

<置換基群 γ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

(25) R^1 が、2-メチルスルホニルフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 δ 4 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホ

ニル基、ブチルスルホニル基、フェニルスルホニル基またはメチルで置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であり、

R^2 が水素原子、メトキシ基または弗素原子であり、

R^3 および R^4 が水素原子であり、

R^5 が、フェニル、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニルまたは3, 4, 5-トリメトキシフェニルまたは1, 1-ジオキソベンゾチオフェン-3-イル基であり、

R^6 が、1-エチルペンチル基、シクロヘキシル基または1-フェニルエチル基である化合物。

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 4>

メチル基、フェニル基およびメチルフェニル基

(26) R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基またはトシルカルバモイルアミノ基であり、

R^2 、 R^3 および R^4 が、水素原子であり、

R^5 が、フェニルまたは2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル基であり、

R^6 が、1-エチルペンチル基または1-フェニルエチル基である化合物。

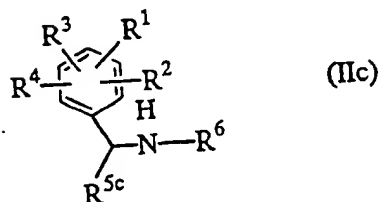
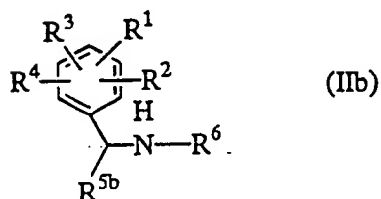
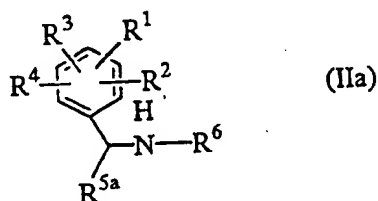
(27) R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基であり、

R^2 、 R^3 および R^4 が、水素原子であり、

R^5 が、フェニル基であり、

R^6 が、1-エチルペンチル基または1-フェニルエチル基である化合物。

本発明の代表化合物は、例えば、表 1、表 2 および表 3 に記載する化合物を例示することができるが、本発明は、これらの化合物に限定されるものではない。なお、表 1、表 2 および表 3 の化合物は、それぞれ式 (IIa)、(IIb) および (IIc) の構造式を有し、一般式 (I) を有する化合物も化合物 (IIa)、(IIb) および (IIc) に含まれる。



但し、上記式中において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、前述したものと同意義を示し、 R^{5a} は置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよいフェニル基を示し、 R^{5b} は置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい、インデニル基またはナフチル基を示し、 R^{5c} は、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル若しくはオキサ

ゾリル基を示す。

表中の略記は、以下の通りである。

B0xa : ベンゾオキサゾリル基

BThi : ベンゾチエニル基

BThiz : ベンゾチアゾリル基

Bu : ブチル基

tBu : t-ブチル基

Bz : ベンジル基

Et : エチル基

Hx : ヘキシル基

cHx : シクロヘキシル基

Ind : インドリル基

Inda : インダニル基

Inde : インデニル基

Me : メチル基

Np : ナフチル基

Oxa : オキサゾリル基

Ph : フェニル基

cPn : シクロペンチル基

nPn : ネオペンチル基

Pn : ペンチル基

Pr : プロピル基

iPr : イソプロピル基

Pyrr : ピロリル基

Thi : チエニル基

Thiz : チアゾリル基

Tol : トリル基

Tz : 1H-テトラゾール-5-イル基。

【表1】

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^{5a}	R ⁶
1-1	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-2	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-3	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-4	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-5	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-6	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-7	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-8	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-9	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-10	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-11	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph)Me
1-12	2-(3-Tz-Ph)	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-13	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-14	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-15	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-16	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-17	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-18	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-19	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-20	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-21	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-22	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-23	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-24	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-25	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-26	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-27	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-28	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-29	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-30	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-31	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-32	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-33	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-34	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-35	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-36	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-37	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-38	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-39	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-40	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-41	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-42	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-43	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-44	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-45	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-46	2-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me

1-47	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-48	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-49	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-50	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-51	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-52	2-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-53	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-54	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-55	3-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-56	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-57	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-58	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-59	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-60	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-61	3-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-62	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-63	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-64	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-65	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-66	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-67	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-68	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-69	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-70	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-71	4-(4-Tz-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-72	2-(3-HO ₃ S-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-73	2-(3-HO ₃ S-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-74	2-(3-HO ₃ S-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-75	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	iPr
1-76	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bu
1-77	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-78	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	nPn
1-79	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-80	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-81	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-82	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-83	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-84	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-85	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-86	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cPn
1-87	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-88	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-89	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-90	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-91	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-92	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-93	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-94	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-95	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-96	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-97	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-98	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me

1-99	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-100	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-101	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-102	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-103	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-104	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-105	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-106	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-107	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-108	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-109	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-110	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-111	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-112	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-113	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	iPr
1-114	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bu
1-115	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-116	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	nPn
1-117	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-118	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-119	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-120	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe 6-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-121	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-122	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-123	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-124	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cPn

1-125	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-126	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-127	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-128	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-129	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-130	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-131	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-132	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-133	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-134	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-135	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-136	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-137	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-138	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-139	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-140	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph)Me
1-141	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-142	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-143	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-144	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-145	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-146	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-147	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-148	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph)Me
1-149	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph)Me
1-150	3-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-151	3-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-152	3-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-153	3-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-154	3-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-155	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-156	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-157	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-158	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-159	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-160	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-161	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-162	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-163	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-164	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	iPr
1-165	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bu
1-166	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-167	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	nPn
1-168	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-169	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-170	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-171	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe 6-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-172	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-173	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-174	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-175	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cPn
1-176	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx

1-177	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-178	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-179	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-180	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-181	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-182	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-183	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-184	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-185	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-186	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-187	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-188	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-189	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-190	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	2-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-191	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-192	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-193	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-194	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-195	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-196	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-197	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-198	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-199	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-200	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-201	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-202	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me

1-203	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	iPr
1-204	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bu
1-205	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-206	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	nPn
1-207	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-208	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-209	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-210	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-211	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-212	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-213	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-214	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cPn
1-215	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-216	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-217	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-218	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-219	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-220	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-221	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-222	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-223	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-224	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-225	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-226	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-227	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-228	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me

1-229	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	2-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-230	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Inda
1-231	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-232	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-233	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-234	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-235	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-236	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-237	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-238	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-239	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-240	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Br-Ph) Me
1-241	2-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-242	2-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-243	2-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-244	2-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-245	2-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-246	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	tBu
1-247	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-248	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-249	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-250	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-251	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-252	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-253	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-254	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me

1-255	3-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-256	3-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-257	3-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-258	3-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-259	3-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-260	3-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-261	3-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-262	3-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-263	3-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-264	4-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-265	4-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-266	4-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-267	4-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-268	4-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-269	4-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-270	4-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-271	4-(3-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-272	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-273	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-274	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-275	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-276	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-277	2-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-278	2-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-279	2-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-280	2-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz

1-281	2-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-282	2-(3-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-283	2-(3-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-284	2-(3-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-285	2-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-286	2-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-287	2-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-288	2-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	Bz
1-289	2-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-290	3-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-291	3-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-292	3-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-293	3-(3-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-294	3-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-295	3-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-296	3-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-297	4-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-298	4-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-299	4-(2-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-300	4-(3-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-301	4-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-302	4-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-303	4-(4-PrSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-304	2-(2-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-305	2-(2-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-306	2-(2-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

1-307	2-(4-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-308	2-(4-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-309	2-(4-BuSO ₂ -Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-310	2-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-311	2-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-312	2-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-313	2-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-314	2-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-315	2-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-316	4-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-317	4-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-318	4-(2-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-319	4-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-320	4-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-321	4-(4-MeSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-322	2-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-323	2-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-324	2-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-325	2-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-326	2-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-327	2-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-328	4-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-329	4-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx
1-330	4-(2-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-331	4-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-332	4-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	cHx

1-333	4-(4-EtSO ₂ HN-Ph)	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-334	2-[4-(2-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	cHx
1-335	2-[4-(3-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	cHx
1-336	2-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-337	2-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	cHx
1-338	2-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-339	2-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-340	3-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	cHx
1-341	4-[4-(4-Tol)SO ₂ HN-Ph]	H	H	H	Ph	cHx
1-342	2-[4-(4-MeO-Ph)SO ₂ HN-Ph]					
		H	H	H	Ph	cHx
1-343	2-[4-(4-F-Ph)SO ₂ HN-Ph]					
		H	H	H	Ph	cHx
1-344	2-[4-(4-Cl-Ph)SO ₂ HN-Ph]					
		H	H	H	Ph	cHx
1-345	2-(3-Tz-Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-346	3-(3-Tz-Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-347	4-(2-Tz-Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-348	4-(3-Tz-Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-349	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-350	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-351	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-352	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-353	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-354	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-355	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx

61

1-356	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-357	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-358	2-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-359	2-Tz	H	H	H	Ph	iPr
1-360	2-Tz	H	H	H	Ph	Bu
1-361	2-Tz	H	H	H	Ph	tBu
1-362	2-Tz	H	H	H	Ph	nPn
1-363	2-Tz	H	H	H	Ph	2-Hx
1-364	2-Tz	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-365	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-366	2-Tz	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-367	2-Tz	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-368	2-Tz	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-369	2-Tz	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-370	2-Tz	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-371	2-Tz	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-372	2-Tz	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-373	2-Tz	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-374	2-Tz	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-375	2-Tz	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-376	2-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-377	2-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-378	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-379	2-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-380	2-Tz	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn
1-381	2-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn

1-382	2-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5*} =4-Me-2-MeO-Ph
1-383	2-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5*} =4-Me-6-F-2-MeO-Ph
1-384	2-Tz	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-385	2-Tz	H	H	H	Ph	cPn
1-386	2-Tz	H	H	H	Ph	cHx
1-387	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-388	2-Tz	4-OMe	H	H	Ph	cHx
1-389	2-Tz	4-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-390	2-Tz	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-391	2-Tz	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-392	2-Tz	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-393	2-Tz	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-394	2-Tz	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-395	2-Tz	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-396	2-Tz	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-397	2-Tz	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-398	2-Tz	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-399	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-400	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-401	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-402	2-Tz	H	H	H	Ph	1-Inda
1-403	2-Tz	H	H	H	Ph	Bz
1-404	2-Tz	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-405	2-Tz	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph

1-406	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-407	2-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-408	2-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-409	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-410	2-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me
1-411	2-Tz	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph) Me
1-412	2-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-413	2-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
R ^{5a} = 2-MeO-4-Me-Ph						
1-414	2-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
R ^{5a} = 6-F-4-Me-2-MeO-Ph						
1-415	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-416	2-Tz	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-417	2-Tz	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-418	2-Tz	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph) Me
1-419	2-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-420	2-Tz	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-421	2-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-422	2-Tz	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-423	2-Tz	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-424	2-Tz	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-425	2-Tz	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-426	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-427	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-428	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-429	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me

64

1-430	2-Tz	H	H	H	Ph	3-Pn
1-431	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-432	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-433	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-434	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-435	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-436	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-437	2-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-438	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-439	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-440	2-Tz	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-441	2-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-442	3-Tz	H	H	H	Ph	iPr
1-443	3-Tz	H	H	H	Ph	Bu
1-444	3-Tz	H	H	H	Ph	tBu
1-445	3-Tz	H	H	H	Ph	nPn
1-446	3-Tz	H	H	H	Ph	2-Hx
1-447	3-Tz	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-448	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-449	3-Tz	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-450	3-Tz	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-451	3-Tz	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-452	3-Tz	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-453	3-Tz	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-454	3-Tz	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-455	3-Tz	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-456	3-Tz	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-457	3-Tz	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-458	3-Tz	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-459	3-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-460	3-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-461	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-462	3-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-463	3-Tz	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn
1-464	3-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-465	3-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-466	3-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-467	3-Tz	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-468	3-Tz	H	H	H	Ph	cPn
1-469	3-Tz	H	H	H	Ph	cHx
1-470	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-471	3-Tz	4-OMe	H	H	Ph	cHx
1-472	3-Tz	4-OMe 6-OH	H	H	Ph	cHx
1-473	3-Tz	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-474	3-Tz	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-475	3-Tz	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-476	3-Tz	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-477	3-Tz	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-478	3-Tz	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-479	3-Tz	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx

1-480	3-Tz	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-481	3-Tz	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-482	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-483	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-484	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-485	3-Tz	H	H	H	Ph	1-Inda
1-486	3-Tz	H	H	H	Ph	Bz
1-487	3-Tz	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-488	3-Tz	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-489	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-490	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-491	3-Tz	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-492	3-Tz	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-493	3-Tz	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph)Me
1-494	3-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-495	3-Tz	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-496	3-Tz	6-F	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-497	3-Tz	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-498	3-Tz	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-499	3-Tz	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-500	3-Tz	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-501	3-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-502	3-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-503	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-504	3-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph)Me
1-505	3-Tz	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph)Me

1-506	3-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-507	3-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-508	3-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-509	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-510	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-511	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-512	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-513	3-Tz	H	H	H	Ph	3-Pn
1-514	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-515	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-516	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-517	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-518	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-519	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-520	3-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-521	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-522	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-523	3-Tz	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-524	3-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-525	4-Tz	H	H	H	Ph	iPr
1-526	4-Tz	H	H	H	Ph	Bu
1-527	4-Tz	H	H	H	Ph	tBu
1-528	4-Tz	H	H	H	Ph	nPn
1-529	4-Tz	H	H	H	Ph	2-Hx

1-530	4-Tz	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-531	4-Tz	2-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-532	4-Tz	2-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-533	4-Tz	2-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-534	4-Tz	2-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-535	4-Tz	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-536	4-Tz	2-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-537	4-Tz	2-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-538	4-Tz	2-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-539	4-Tz	2-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-540	4-Tz	2-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-541	4-Tz	2-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-542	4-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-543	4-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-544	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-545	4-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-546	4-Tz	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn
1-547	4-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-548	4-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{6a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-549	4-Tz	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{6a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-550	4-Tz	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-551	4-Tz	H	H	H	Ph	cPn
1-552	4-Tz	H	H	H	Ph	cHx
1-553	4-Tz	2-Me	H	H	Ph	cHx

1-554	4-Tz	2-OMe	H	H	Ph	cHx
1-555	4-Tz	2-OMe 6-OH	H		Ph	cHx
1-556	4-Tz	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-557	4-Tz	2-OH	H	H	Ph	cHx
1-558	4-Tz		H	H	H Ph	4-Me-cHx
1-559	4-Tz		H	H	H Ph	4-t Bu-cHx
1-560	4-Tz		H	H	H Ph	4-MeO-cHx
1-561	4-Tz		H	H	H Ph	4-F-cHx
1-562	4-Tz		H	H	H Ph	4-Cl-cHx
1-563	4-Tz		H	H	H Ph	4-HO-cHx
1-564	4-Tz		H	H	H Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-565	4-Tz		H	H	H Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-566	4-Tz		H	H	H Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-567	4-Tz		H	H	H Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-568	4-Tz		H	H	H Ph	1-Inda
1-569	4-Tz		H	H	H Ph	Bz
1-570	4-Tz		H	H	H Ph	4-Me-Bz
1-571	4-Tz		H	H	H Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-572	4-Tz		H	H	H Ph	-CH(Ph) Me
1-573	4-Tz	2-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-574	4-Tz	2-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-575	4-Tz	2-OMe 6-OH	H		Ph	-CH(Ph) Me
1-576	4-Tz	2-OMe 5-F 6-OH			Ph	-CH(Ph) Me
1-577	4-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-578	4-Tz	2-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-579	4-Tz	2-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

1-580	4-Tz	2-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-581	4-Tz	2-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-582	4-Tz	2-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-583	4-Tz	2-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-584	4-Tz	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-585	4-Tz	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-586	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-587	4-Tz	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me
1-588	4-Tz	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph) Me
1-589	4-Tz	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-590	4-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5*} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-591	4-Tz	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5*} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-592	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-593	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-594	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-595	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-596	4-Tz	H	H	H	Ph	3-Pn
1-597	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-598	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-599	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-600	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-601	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-602	4-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-603	4-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me

1-604	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-605	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-606	4-Tz	H	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-607	4-Tz	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (1-Np) Me
1-608	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-609	2-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-610	2-Tz	4-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-611	2-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-612	2-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-613	2-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-614	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-615	3-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-616	3-Tz	4-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-617	3-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-618	3-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-619	3-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-620	4-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-621	4-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-622	4-Tz	4-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-623	4-Tz	6-OMe	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-624	4-Tz	4-Me	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-625	4-Tz	4-F	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-626	2- (cPn) HNOC	H	H	H	Pn	cHx
1-627	2- (cHx) HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-628	2- (cHx) HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-629	2- (cHx) HNOC	H	H	H	Ph	CH ₂ (Ph) Me

1-630	2-(cHx) HNOC	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-631	3-(cHx) HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-632	4-(cHx) HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-633	2-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-634	2-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-635	2-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-636	2-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-637	2-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-638	3-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-639	3-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-640	3-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-641	4-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-642	4-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-643	4-MeSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-644	2-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-645	2-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-646	2-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-647	3-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-648	3-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-649	4-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-650	4-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-651	4-EtSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-652	2-PrSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-653	2-BuSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-654	2-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-655	2-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx

1-656	2-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-657	2-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-658	2-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-659	2-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-660	2-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-661	2-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-662	2-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-663	2-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-664	2-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-665	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-666	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-667	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-668	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-669	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-670	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-671	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-672	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-673	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-674	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-675	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	iPr
1-676	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bu
1-677	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	tBu
1-678	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	nPn
1-679	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-680	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-681	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-682	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OMe 6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-683	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	6-OMe	H	H	1-Et-Pn
1-684	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OH	H	H	1-Et-Pn
1-685	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Et-Hx
1-686	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	cPn
1-687	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	cHx
1-688	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-MeO-cHx
1-689	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-F-cHx
1-690	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-Cl-cHx
1-691	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-HO-cHx
1-692	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-Me-cHx
1-693	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	4-tBu-cHx
1-694	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Bz
1-695	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-696	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	-CH(Ph)Me
1-697	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-Me	H	H	-CH(Ph)Me
1-698	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OMe	H	H	-CH(Ph)Me
1-699	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OMe 6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-700	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	6-OMe	H	H	-CH(Ph)Me
1-701	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	4-OH	H	H	-CH(Ph)Me
1-702	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Inda
1-703	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	-CH(4-Br-Ph)Me
1-704	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	-CH(1-Np)Me
1-705	4-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Et-Pn
1-706	4-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	cHx
1-707	4-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	-CH(Ph)Me

1-708	4-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-709	4-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-710	4-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-711	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-712	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-713	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-714	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-715	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-716	2-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-717	2-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-718	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-719	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-720	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-721	3-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-722	3-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-723	3-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-724	3-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-725	3-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-726	3-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-727	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-728	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-729	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-730	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-731	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-732	3-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-733	3-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx

1-734	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-735	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-736	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-737	2-(4-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-738	3-(4-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-739	4-(2-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-740	4-(3-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-741	4-(4-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-742	4-(4-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-743	4-(4-Pr-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-744	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-745	3-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-746	4-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-747	4-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-748	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-749	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-750	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-751	4-(4-EtO-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-752	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-753	3-(4-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-754	4-(2-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-755	4-(3-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-756	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-757	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-758	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-759	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx

1-760	3-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-761	4-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-762	4-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-763	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-764	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-765	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-766	2-PhSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-767	3-PhSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-768	3-PhSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-769	3-PhSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-770	4-PhSO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-771	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-772	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-773	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-774	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-775	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-776	2-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-777	2-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-778	2-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-779	2-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-780	2-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-781	2-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-782	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	iPr
1-783	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bu
1-784	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	tBu
1-785	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	nPn

1-786	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-787	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-788	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cPn
1-789	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-790	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-791	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-792	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-793	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-794	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-795	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-796	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-797	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-798	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-799	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-800	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-801	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-802	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-803	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-804	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-805	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-806	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-807	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me

1-808	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Inda
1-809	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph)Me
1-810	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(1-Np)Me
1-811	3-[2-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-812	3-[2-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-813	3-[2-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-814	3-[2-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-815	3-[2-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-816	3-[2-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-817	3-[2-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-818	3-[2-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-819	3-[2-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-820	3-[2-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-821	3-[3-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-822	3-[3-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-823	3-[3-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-824	3-[3-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-825	3-[3-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-826	3-[3-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-827	3-[3-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-828	3-[3-(3-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-829	3-[3-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-830	3-[3-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-831	3-[3-(4-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-832	3-[4-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-833	3-[4-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx

1-834	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-835	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-836	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-837	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-838	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-839	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-840	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-841	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-842	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-843	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-844	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-845	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-846	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	Bz
1-847	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-848	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-849	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-850	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-851	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-852	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	cHx
1-853	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-854	4-[2-(2-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-855	4-[2-(2-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	Ph	cHx
1-856	4-[2-(2-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

1-857	4-[2-(3-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-858	4-[2-(4-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-859	4-[2-(4-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-860	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-861	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-862	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-863	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-864	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-865	4-[2-(2-F-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-866	4-[2-(2-F-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-867	4-[2-(2-F-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-868	4-[2-(3-F-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-869	4-[2-(4-F-Ph) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-870	2-HO ₃ S	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-871	2-HO ₃ S	H	H	H	Ph	cHx
1-872	2-HO ₃ S	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-873	3-HO ₃ S	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-874	3-HO ₃ S	H	H	H	Ph	cHx

1-875	3-HO ₃ S	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-876	4-HO ₃ S	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-877	4-HO ₃ S	H	H	H	Ph	cHx
1-878	4-HO ₃ S	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-879	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-880	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-881	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-882	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-883	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hx
1-884	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-885	2-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-886	2-MeSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-887	2-MeSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-888	2-MeSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-889	2-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-890	2-MeSO ₂	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-891	2-MeSO ₂	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-892	2-MeSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-893	2-MeSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-894	2-MeSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-895	2-MeSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-896	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-897	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-898	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-899	2-MeSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-900	2-MeSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn

1-901	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-902	2-MeSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{6a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-903	2-MeSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{6a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-904	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-905	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-906	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-907	2-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-908	2-MeSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	cHx
1-909	2-MeSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-910	2-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-911	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	cHx
1-912	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	cHx
1-913	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	cHx
1-914	2-MeSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	cHx
1-915	2-MeSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	cHx
1-916	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	cHx
1-917	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-918	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-919	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-920	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-921	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-922	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-923	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-924	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)

84

1-925	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-926	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-927	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-928	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-929	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-930	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-931	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-932	2-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-933	2-MeSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-934	2-MeSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-935	2-MeSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph)Me
1-936	2-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-937	2-MeSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-938	2-MeSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-939	2-MeSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-940	2-MeSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-941	2-MeSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-942	2-MeSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-943	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-944	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-945	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-946	2-MeSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph)Me
1-947	2-MeSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph)Me
1-948	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph)Me
1-949	2-MeSO ₂	H	H	H		-CH(Ph)Me

R⁵=4-Me-2-MeO-Ph

1-950	2-MeSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-951	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-952	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-953	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-954	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-955	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn
1-956	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-957	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-958	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-959	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-960	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-961	2-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-962	2-MeSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-963	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-964	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-965	2-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-966	2-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-967	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-968	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-969	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-970	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-971	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hx
1-972	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-973	3-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-974	3-MeSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-975	3-MeSO ₂	4-OMe 6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-976	3-MeSO ₂	4-OMe 5-F 6-OH	Ph		1-Et-Pn
1-977	3-MeSO ₂	6-OMe	H H	Ph	1-Et-Pn
1-978	3-MeSO ₂	4-OH	H H	Ph	1-Et-Pn
1-979	3-MeSO ₂	4-F	H H	Ph	1-Et-Pn
1-980	3-MeSO ₂	4-Cl	H H	Ph	1-Et-Pn
1-981	3-MeSO ₂	4-NH ₂	H H	Ph	1-Et-Pn
1-982	3-MeSO ₂	4-NHMe	H H	Ph	1-Et-Pn
1-983	3-MeSO ₂	4-N (Me) ₂	H H	Ph	1-Et-Pn
1-984	3-MeSO ₂	H H H	2-Me-Ph		1-Et-Pn
1-985	3-MeSO ₂	H H H	3-Me-Ph		1-Et-Pn
1-986	3-MeSO ₂	H H H	4-Me-Ph		1-Et-Pn
1-987	3-MeSO ₂	H H H	4-MeO-Ph		1-Et-Pn
1-988	3-MeSO ₂	H H H	4-F -Ph		1-Et-Pn
1-989	3-MeSO ₂	H H H	4-Cl-Ph		1-Et-Pn
1-990	3-MeSO ₂	H H H			1-Et-Pn
			R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph		
1-991	3-MeSO ₂	H H H			1-Et-Pn
			R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph		
1-992	3-MeSO ₂	H H H	Ph		2-Et-Hx
1-993	3-MeSO ₂	H H H	Ph		cPn
1-994	3-MeSO ₂	H H H	Ph		cHx
1-995	3-MeSO ₂	4-Me	H H	Ph	cHx
1-996	3-MeSO ₂	4-OMe	H H	Ph	cHx
1-997	3-MeSO ₂	4-OMe 6-OH	H	Ph	cHx
1-998	3-MeSO ₂	6-OMe	H H	Ph	cHx

1-999	3-MeSO ₂	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-1000	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1001	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1002	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1003	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1004	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1005	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1006	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1007	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1008	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1009	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1010	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1011	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1012	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1013	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1014	3-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1015	3-MeSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1016	3-MeSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1017	3-MeSO ₂	4-OMe 6-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1018	3-MeSO ₂	4-OMe 5-F 6-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1019	3-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1020	3-MeSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1021	3-MeSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1022	3-MeSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1023	3-MeSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1024	3-MeSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me

1-1025	3-MeSO ₂	4-N (Me) ₂	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1026	3-MeSO ₂		H	H	H 2-Me-Ph	-CH (Ph) Me
1-1027	3-MeSO ₂		H	H	H 3-Me-Ph	-CH (Ph) Me
1-1028	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Me-Ph	-CH (Ph) Me
1-1029	3-MeSO ₂		H	H	H 4-MeO-Ph	-CH (Ph) Me
1-1030	3-MeSO ₂		H	H	H 4-F -Ph	-CH (Ph) Me
1-1031	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Cl-Ph	-CH (Ph) Me
1-1032	3-MeSO ₂		H	H	H	-CH (Ph) Me
						R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph
1-1033	3-MeSO ₂		H	H	H	-CH (Ph) Me
						R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph
1-1034	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (4-Me-Ph) Me
1-1035	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (4-MeO-Ph) Me
1-1036	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (4-F-Ph) Me
1-1037	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (4-Cl-Ph) Me
1-1038	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	3-Pn
1-1039	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Me-Ph	3-Pn
1-1040	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (cHx) Me
1-1041	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Me-Ph	-CH (cHx) Me
1-1042	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1043	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Me-Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1044	3-MeSO ₂	4-Me	H	H	H Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1045	3-MeSO ₂	4-F	H	H	H Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1046	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1047	3-MeSO ₂		H	H	H 4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1048	3-MeSO ₂		H	H	H Ph	-CH (1-Np) Me

1-1049	3-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-1050	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1051	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1052	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1053	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1054	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hx
1-1055	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1056	4-MeSO ₂	2-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1057	4-MeSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1058	4-MeSO ₂	2-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1059	4-MeSO ₂	2-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-1060	4-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1061	4-MeSO ₂	2-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1062	4-MeSO ₂	2-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1063	4-MeSO ₂	2-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1064	4-MeSO ₂	2-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1065	4-MeSO ₂	2-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1066	4-MeSO ₂	2-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1067	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1068	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1069	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1070	4-MeSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-1071	4-MeSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn
1-1072	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-1073	4-MeSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn

R^{5a}=4-Me-2-MeO-Ph

1-1074	4-MeSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{6a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph
1-1075	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1076	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-1077	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1078	4-MeSO ₂	2-Me	H	H	Ph	cHx
1-1079	4-MeSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1080	4-MeSO ₂	2-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-1081	4-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1082	4-MeSO ₂	2-OH	H	H	Ph	cHx
1-1083	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1084	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1085	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1086	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1087	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1088	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1089	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1090	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1091	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1092	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1093	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1094	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1095	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1096	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1097	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1098	4-MeSO ₂	2-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me

1-1099	4-MeSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1100	4-MeSO ₂	2-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1101	4-MeSO ₂	2-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph) Me
1-1102	4-MeSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1103	4-MeSO ₂	2-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1104	4-MeSO ₂	2-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1105	4-MeSO ₂	2-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1106	4-MeSO ₂	2-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1107	4-MeSO ₂	2-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1108	4-MeSO ₂	2-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1109	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1110	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1111	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1112	4-MeSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me
1-1113	4-MeSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph) Me
1-1114	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-1115	4-MeSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1116	4-MeSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1117	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1118	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1119	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1120	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1121	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn
1-1122	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn

1-1123	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-1124	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (cHx) Me
1-1125	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1126	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1127	4-MeSO ₂	2-Me	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1128	4-MeSO ₂	2-F	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1129	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1130	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1131	4-MeSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-1132	4-MeSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (1-Np) Me
1-1133	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1134	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1135	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1136	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1137	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hex
1-1138	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1139	2-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1140	2-EtSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1141	2-EtSO ₂	4-OMe 6-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1142	2-EtSO ₂	4-OMe 5-F 6-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1143	2-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1144	2-EtSO ₂	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1145	2-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1146	2-EtSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1147	2-EtSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1148	2-EtSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-1149	2-EtSO ₂	4-N (Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn	
1-1150	2-EtSO ₂		H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1151	2-EtSO ₂		H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1152	2-EtSO ₂		H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1153	2-EtSO ₂		H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-1154	2-EtSO ₂		H	H	H	4-F -Ph	1-Et-Pn
1-1155	2-EtSO ₂		H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-1156	2-EtSO ₂		H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1157	2-EtSO ₂		H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1158	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1159	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	cPn
1-1160	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	cHx
1-1161	2-EtSO ₂	4-Me	H	H	H	Ph	cHx
1-1162	2-EtSO ₂	4-OMe	H	H	H	Ph	cHx
1-1163	2-EtSO ₂	4-OMe 6-OH	H	H	H	Ph	cHx
1-1164	2-EtSO ₂	6-OMe	H	H	H	Ph	cHx
1-1165	2-EtSO ₂	4-OH	H	H	H	Ph	cHx
1-1166	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1167	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1168	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1169	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1170	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1171	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1172	2-EtSO ₂		H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx

1-1173	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1174	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1175	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-MeOOC-cHx)
1-1176	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1177	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1178	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1179	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1180	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1181	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1182	2-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1183	2-EtSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1184	2-EtSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1185	2-EtSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph)Me
1-1186	2-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1187	2-EtSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1188	2-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1189	2-EtSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1190	2-EtSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1191	2-EtSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1192	2-EtSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1193	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1194	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1195	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1196	2-EtSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph)Me
1-1197	2-EtSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph)Me
1-1198	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph)Me

1-1199	2-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1200	2-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1201	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1202	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1203	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1204	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1205	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn
1-1206	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-1207	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-1208	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-1209	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1210	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1211	2-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1212	2-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1213	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1214	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1215	2-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-1216	2-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-1217	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1218	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1219	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1220	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1221	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hex
1-1222	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-1223	3-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1224	3-EtSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1225	3-EtSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1226	3-EtSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-1227	3-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1228	3-EtSO ₂	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1229	3-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1230	3-EtSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1231	3-EtSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1232	3-EtSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1233	3-EtSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1234	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1235	3-EtSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1236	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1237	3-EtSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-1238	3-EtSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	1-Et-Pn
1-1239	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-1240	3-EtSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph						
1-1241	3-EtSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph						
1-1242	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1243	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-1244	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1245	3-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-1246	3-EtSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	cHx

1-1247	3-EtSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-1248	3-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1249	3-EtSO ₂	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-1250	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1251	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1252	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1253	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1254	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1255	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1256	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1257	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ - (4-HOH ₂ C-cHx)
1-1258	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ - (4-HOOC-cHx)
1-1259	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ - [4- (Me) ₂ NOC-cHx]
1-1260	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1261	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1262	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1263	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1264	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1265	3-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1266	3-EtSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1267	3-EtSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1268	3-EtSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH (Ph) Me
1-1269	3-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1270	3-EtSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1271	3-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1272	3-EtSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	-CH (Ph) Me

1-1273	3-EtSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1274	3-EtSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1275	2-EtSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1276	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1277	3-EtSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1278	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1279	3-EtSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me
1-1280	3-EtSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph) Me
1-1281	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-1282	3-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1283	3-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1284	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1285	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1286	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1287	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1288	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn
1-1289	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-1290	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-1291	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-1292	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1293	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1294	3-EtSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1295	3-EtSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1296	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)

1-1297	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1298	3-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-1299	3-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (1-Np) Me
1-1300	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1301	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1302	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1303	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1304	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hex
1-1305	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1306	4-EtSO ₂	2-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1307	4-EtSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1308	4-EtSO ₂	2-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1309	4-EtSO ₂	2-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-1310	4-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1311	4-EtSO ₂	2-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1312	4-EtSO ₂	2-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1313	4-EtSO ₂	2-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1314	4-EtSO ₂	2-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1315	4-EtSO ₂	2-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1316	4-EtSO ₂	2-N (Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1317	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1318	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1319	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1320	4-EtSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-1321	4-EtSO ₂	H	H	H	4-F -Ph	1-Et-Pn
1-1322	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn

100

1-1323	4-EtSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph
1-1324	4-EtSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
						R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph
1-1325	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1326	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-1327	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1328	4-EtSO ₂	2-Me	H	H	Ph	cHx
1-1329	4-EtSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1330	4-EtSO ₂	2-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-1331	4-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1332	4-EtSO ₂	2-OH	H	H	Ph	cHx
1-1333	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1334	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1335	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1336	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1337	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1338	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1339	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1340	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1341	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1342	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1343	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1344	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1345	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1346	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me

101

1-1347	4-EtSO ₂	2-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1348	4-EtSO ₂	2-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1349	4-EtSO ₂	2-OMe 6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me	
1-1350	4-EtSO ₂	2-OMe 5-F 6-OH	Ph	-CH(Ph) Me		
1-1351	4-EtSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1352	4-EtSO ₂	2-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1353	4-EtSO ₂	2-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1354	4-EtSO ₂	2-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1355	4-EtSO ₂	2-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1356	4-EtSO ₂	2-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1357	4-EtSO ₂	2-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1358	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1359	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1360	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1361	4-EtSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me
1-1362	4-EtSO ₂	H	H	H	4-F -Ph	-CH(Ph) Me
1-1363	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-1364	4-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5*} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1365	4-EtSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5*} =4-Me-6-F-2-MeO-Ph	
1-1366	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1367	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1368	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1369	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1370	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn

1-1371	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-1372	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (cHx) Me
1-1373	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (cHx) Me
1-1374	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1375	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1376	4-EtSO ₂	2-Me	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1377	4-EtSO ₂	2-F	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1378	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1379	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1380	4-EtSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (1-Np) Me
1-1381	4-EtSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH (1-Np) Me
1-1382	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1383	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1384	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1385	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1386	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1387	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1388	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (Ph) Me
1-1389	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (4-Me-Ph) Me
1-1390	2-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH (4-Br-Ph) Me
1-1391	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1392	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1393	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1394	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1395	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1396	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	Bz

1-1397	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1398	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1399	3-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1400	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1401	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1402	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1403	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1404	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1405	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1406	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1407	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1408	4-PrSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1409	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1410	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1411	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1412	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1413	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	2-Hx
1-1414	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1415	2-BuSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1416	2-BuSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1417	2-BuSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1418	2-BuSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-1419	2-BuSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1420	2-BuSO ₂	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1421	2-BuSO ₂	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1422	2-BuSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn

104

1-1423	2-BuSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1424	2-BuSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1425	2-BuSO ₂	4-N (Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1426	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1427	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1428	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	1-Et-Pn
1-1429	2-BuSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	1-Et-Pn
1-1430	2-BuSO ₂	H	H	H	4-F -Ph	1-Et-Pn
1-1431	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	1-Et-Pn
1-1432	2-BuSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1433	2-BuSO ₂	H	H	H		1-Et-Pn
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1434	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1435	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-1436	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1437	2-BuSO ₂	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-1438	2-BuSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1439	2-BuSO ₂	4-OMe 6-OH	H	H	Ph	cHx
1-1440	2-BuSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1441	2-BuSO ₂	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-1442	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1443	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1444	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1445	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1446	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx

1-1447	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1448	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1449	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1450	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1451	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1452	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1453	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1454	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1455	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1456	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1457	2-BuSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1458	2-BuSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1459	2-BuSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1460	2-BuSO ₂	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph)Me
1-1461	2-BuSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1462	2-BuSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1463	2-BuSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1464	2-BuSO ₂	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1465	2-BuSO ₂	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1466	2-BuSO ₂	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1467	2-BuSO ₂	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1468	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1469	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1470	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1471	2-BuSO ₂	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph)Me
1-1472	2-BuSO ₂	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph)Me

1-1473	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-1474	2-BuSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1475	2-BuSO ₂	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1476	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1477	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1478	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1479	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1480	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	3-Pn
1-1481	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	3-Pn
1-1482	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-1483	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(cHx) Me
1-1484	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1485	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1486	2-BuSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1487	2-BuSO ₂	4-F	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1488	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1489	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH ₂ (4-H ₂ NOC-Ph)
1-1490	2-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-1491	2-BuSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(1-Np) Me
1-1492	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	t Bu
1-1493	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1494	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1495	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1496	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx

1-1497	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1498	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1499	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1500	3-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1501	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1502	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1503	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1504	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1505	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1506	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1507	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1508	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1509	4-BuSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1510	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	iPr
1-1511	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	Bu
1-1512	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1513	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	nPn
1-1514	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1515	2-PhSO ₂	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1516	2-PhSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1517	2-PhSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1518	2-PhSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1519	2-PhSO ₂	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1520	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1521	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	cPn
1-1522	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	cHx

1-1523	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1524	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-F-cHx
1-1525	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1526	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1527	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1528	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1529	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1530	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1531	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1532	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1533	2-PhSO ₂	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1534	2-PhSO ₂	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1535	2-PhSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1536	2-PhSO ₂	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1537	2-PhSO ₂	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1538	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1539	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-1540	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1541	2-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-1542	2-(2-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1543	2-(2-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1544	2-(2-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1545	2-(2-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1546	2-(2-Et-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1547	2-(2-MeO-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1548	2-(2-F-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu

1-1549	2-(2-Cl-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1550	2-(3-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1551	2-(3-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1552	2-(3-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1553	2-(3-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1554	2-(3-Et-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1555	2-(3-MeO-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1556	2-(3-F-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1557	2-(3-Cl-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1558	2-(4-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1559	2-(4-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1560	2-(4-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1561	2-(4-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1562	2-(4-Tol) SO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1563	2-(4-Et-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1564	2-(4-MeO-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1565	2-(4-F-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1566	2-(4-Cl-Ph) SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1567	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1568	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1569	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1570	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1571	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1572	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1573	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1574	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me

1-1575	3-(4-Tol)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1576	3-(4-MeO-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1577	3-(4-F-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1578	3-(4-Cl-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1579	3-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph)Me
1-1580	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1581	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1582	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1583	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1584	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1585	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	Bz
1-1586	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1587	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph)Me
1-1588	4-PhSO ₂	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph)Me
1-1589	4-(4-Tol)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1590	4-(4-MeO-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1591	4-(4-F-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1592	4-(4-Cl-Ph)SO ₂	H	H	H	Ph	tBu
1-1593	2-PhSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1594	3-PhSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1595	4-PhSO ₂	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph)Me
1-1596	2-MeHNSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1597	3-MeHNSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1598	4-MeHNSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1599	4-EtHNSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1600	2-(Me) ₂ NSO ₂	H	H	H	Ph	cHx

1-1601	3-(Me) ₂ NSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1602	3-(Me) ₂ NSO ₂	4-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-1603	4-(Me) ₂ NSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1604	4-(Et) ₂ NSO ₂	H	H	H	Ph	cHx
1-1605	2-MeSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1606	2-MeSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1607	2-MeSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1608	2-MeSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1609	2-MeSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1610	3-MeSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1611	3-MeSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1612	3-MeSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1613	3-MeSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1614	3-MeSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1615	4-MeSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1616	4-MeSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1617	4-MeSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1618	4-MeSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1619	4-MeSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1620	2-EtSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1621	2-EtSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1622	2-EtSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1623	2-EtSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1624	2-EtSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph)Me
1-1625	3-EtSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1626	3-EtSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx

1-1627	3-EtSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1628	3-EtSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1629	3-EtSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1630	4-EtSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1631	4-EtSO	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1632	4-EtSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1633	4-EtSO	H	H	H	Ph	Bz
1-1634	4-EtSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1635	2-PrSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1636	2-PrSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1637	2-PrSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1638	3-PrSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1639	3-PrSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1640	3-PrSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1641	4-PrSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1642	4-PrSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1643	4-PrSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1644	2-BuSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1645	2-BuSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1646	2-BuSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1647	3-BuSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1648	3-BuSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1649	3-BuSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1650	4-BuSO	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1651	4-BuSO	H	H	H	Ph	cHx
1-1652	4-BuSO	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

1-1653	2-PhOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1654	2-PhOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1655	2-PhOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1656	3-PhOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1657	3-PhOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1658	3-PhOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1659	3-PhOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1660	3-PhOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1661	3-(4-Tol) OCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1662	4-PhOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1663	4-PhOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1664	4-PhOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1665	2-TzOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1666	2-TzOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1667	2-TzOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1668	3-TzOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1669	3-TzOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1670	3-TzOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1671	3-TzOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1672	3-TzOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1673	4-TzOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1674	4-TzOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1675	4-TzOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1676	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	tBu
1-1677	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1678	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx

1-1679	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1680	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1681	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1682	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1683	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1684	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	tBu
1-1685	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1686	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1687	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1688	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1689	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1690	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1691	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1692	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	iPr
1-1693	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bu
1-1694	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	tBu
1-1695	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	nPn
1-1696	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Hex
1-1697	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1698	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-Me	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1699	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1700	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	6-OH	H	Ph	1-Et-Pn
1-1701	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	1-Et-Pn
1-1702	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	6-OMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1703	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OH	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1704	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-F	H	H	Ph	1-Et-Pn

1-1705	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-Cl	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1706	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-NH ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1707	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-NHMe	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1708	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1709	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	2-Me	1-Et-Pn
1-1710	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	3-Me	1-Et-Pn
1-1711	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	4-Me	1-Et-Pn
1-1712	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	4-OMe	1-Et-Pn
1-1713	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	4-F	1-Et-Pn
1-1714	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	4-Cl	1-Et-Pn
1-1715	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H		1-Et-Pn
R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph							
1-1716	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H		1-Et-Pn
R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph							
1-1717	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1718	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	cPn
1-1719	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	cHx
1-1720	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-Me	H	H	Ph	cHx
1-1721	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1722	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-OMe	6-OH	H	Ph	cHx
1-1723	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	6-OMe	H	H	Ph	cHx
1-1724	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN	4-OH	H	H	Ph	cHx
1-1725	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	4-Me-cHx
1-1726	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	4-tBu-cHx
1-1727	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	4-MeO-cHx
1-1728	2-(4-Tol)	SO ₂ HNOCHN		H	H	Ph	4-F-cHx

1-1729	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-Cl-cHx
1-1730	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-HO-cHx
1-1731	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-HOH ₂ C-cHx
1-1732	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOH ₂ C-cHx)
1-1733	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH ₂ -(4-HOOC-cHx)
1-1734	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH ₂ -[4-(Me) ₂ NOC-cHx]
1-1735	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Inda
1-1736	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1737	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	4-Me-Bz
1-1738	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-(CH ₂) ₂ -Ph
1-1739	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1740	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-Me	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1741	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1742	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	6-OH	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1743	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OMe	5-F	6-OH	Ph	-CH(Ph) Me
1-1744	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	6-OMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1745	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-OH	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1746	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1747	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-Cl	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1748	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-NH ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1749	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-NHMe	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1750	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	4-N(Me) ₂	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1751	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1752	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1753	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(Ph) Me
1-1754	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	4-MeO-Ph	-CH(Ph) Me

1-1755	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	4-F-Ph	-CH(Ph) Me
1-1756	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	4-Cl-Ph	-CH(Ph) Me
1-1757	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =4-Me-2-MeO-Ph	
1-1758	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H		-CH(Ph) Me
					R ^{5a} =6-F-4-Me-2-MeO-Ph	
1-1759	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-Me-Ph) Me
1-1760	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-MeO-Ph) Me
1-1761	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-F-Ph) Me
1-1762	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-Cl-Ph) Me
1-1763	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	3-Pn
1-1764	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(cHx) Me
1-1765	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1766	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(H ₂ NOC-Ph) Me
1-1767	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(1-Np) Me
1-1768	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	4-Me-Ph	-CH(4-Br-Ph) Me
1-1769	3-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1770	3-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1771	3-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1772	3-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1773	3-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1774	3-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1775	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1776	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1777	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1778	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz

1-1779	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1780	4-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1781	4-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1782	4-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1783	4-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1785	4-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1786	4-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1787	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1788	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1789	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1790	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1791	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1792	2-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1793	2-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1794	2-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1795	2-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1796	2-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1797	2-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1798	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1799	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1800	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1801	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1802	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1803	3-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1804	3-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1805	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx

1-1806	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1807	3-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1808	4-(2-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1809	4-(3-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1810	4-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1811	4-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1812	4-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1813	2-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1814	2-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1815	2-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1816	2-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1817	2-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1818	2-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1819	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1820	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1821	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1822	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1823	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1824	3-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1825	3-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1826	3-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1827	3-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1828	3-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1829	4-(2-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1830	4-(3-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1831	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx

120

1-1832	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1833	4-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1834	2-(2-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1835	2-(2-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1836	2-(2-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1837	2-(3-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1838	2-(3-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1839	2-(3-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1840	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1841	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1842	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1843	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1844	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1845	3-(2-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1846	3-(3-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1847	3-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1848	3-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1849	3-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1850	4-(2-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1851	4-(3-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1852	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1853	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1854	4-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1855	2-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1856	2-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1857	2-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

1-1858	2-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1859	2-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1860	2-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1861	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	1-Et-Pn
1-1862	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	2-Et-Hx
1-1863	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1864	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1865	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1866	3-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1867	3-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1868	3-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1869	3-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1870	3-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1871	4-(2-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1872	4-(3-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1873	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	cHx
1-1874	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	Bz
1-1875	4-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	Ph	-CH(Ph) Me
1-1876	3-Tz	6-F	H	H	Ph	-CH(Ph) Me

【表 2】

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^{5b}	R ⁶
2-1	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-2	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx

2-3	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	cHx
2-4	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-5	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-6	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-7	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-8	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-9	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	cHx
2-10	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-11	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-12	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-13	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	cHx
2-14	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Inde	cHx
2-15	3-Tz	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-16	3-Tz	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-17	3-Tz	H	H	H	2-Inde	cHx
2-18	3-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-19	3-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-20	3-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-21	4-Tz	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-22	4-Tz	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-23	4-Tz	H	H	H	2-Inde	cHx
2-24	4-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-25	4-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-26	4-Tz	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-27	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-28	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me

2-29	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-30	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-31	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-32	4-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-33	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-34	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-35	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-36	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-37	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-38	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-39	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-40	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-41	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-42	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-43	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-44	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-45	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-46	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-47	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-48	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-49	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-50	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-51	3-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-52	3-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-53	3-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-54	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn

2-55	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-56	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-57	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-58	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-59	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-60	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-61	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-62	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-63	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-64	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-65	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-66	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-67	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-68	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-69	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-70	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-71	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-72	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-73	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-74	2-PrSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-75	4-PrSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-76	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-77	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	cHx
2-78	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-79	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-80	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me

2-81	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-82	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-83	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-84	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-85	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-86	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-87	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-88	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-89	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-90	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-91	3-PhSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-92	4-PhSO ₂	H	H	H	2-Inde	cHx
2-93	2-(2-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-94	2-(3-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-95	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	1-Et-Pn
2-96	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	cHx
2-97	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-98	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-(5-Me-Inde)	-CH(Ph) Me
2-99	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-100	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(1-Np) Me
2-101	3-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-102	4-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-103	2-MeSO	H	H	H	2-Inde	cHx
2-104	2-MeSO	H	H	H	2-Inde	-CH(Ph) Me
2-105	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-106	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx

2-107	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	cHx
2-108	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-109	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-110	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-111	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-112	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-113	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	cHx
2-114	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-115	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-116	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-117	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	cHx
2-118	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Inde	cHx
2-119	3-Tz	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-120	3-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-121	3-Tz	H	H	H	3-Inde	cHx
2-122	3-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-123	3-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-124	3-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-125	4-Tz	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-126	4-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-127	4-Tz	H	H	H	3-Inde	cHx
2-128	4-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-129	4-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-130	4-Tz	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-131	3-(2-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-132	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me

2-133	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-134	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-135	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-136	4-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-137	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-138	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-139	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-140	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-141	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-142	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-143	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-144	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-145	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-146	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-147	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-148	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-149	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-150	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-151	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-152	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-153	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-154	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-155	3-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-156	3-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-157	3-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-158	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn

2-159	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-160	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-161	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-162	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-163	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-164	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-165	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-166	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-167	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-168	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-169	3-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-170	3-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-171	3-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-172	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-173	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-174	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-175	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-176	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-177	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-178	2-PrSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-179	4-PrSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-180	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-181	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	cHx
2-182	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-183	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-184	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me

2-185	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-186	3-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-187	3-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-188	3-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-189	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-190	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-191	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-192	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-193	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-194	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-195	3-PhSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-196	4-PhSO ₂	H	H	H	3-Inde	cHx
2-197	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-198	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-199	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	1-Et-Pn
2-200	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	cHx
2-201	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-202	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-(5-Me-Inde)	-CH(Ph) Me
2-203	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(4-Br-Ph) Me
2-204	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(1-Np) Me
2-205	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-206	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-207	2-MeSO	H	H	H	3-Inde	cHx
2-208	2-MeSO	H	H	H	3-Inde	-CH(Ph) Me
2-209	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-210	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx

2-211	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-212	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-213	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	Bz
2-214	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-215	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-216	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np) Me
2-217	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-218	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-219	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-220	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-221	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-222	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-223	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-224	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-225	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-226	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	Bz
2-227	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-228	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-229	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-230	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-231	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-232	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-233	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx
2-234	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-235	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-236	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	1-Np	cHx

131

2-237	2-Tz	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-238	2-Tz	H	H	H	1-Np	cHx
2-239	2-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-240	2-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-241	2-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np) Me
2-242	3-Tz	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-243	3-Tz	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-244	3-Tz	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-245	3-Tz	H	H	H	1-Np	cHx
2-246	3-Tz	H	H	H	1-Np	Bz
2-247	3-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-248	3-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-249	3-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np) Me
2-250	4-Tz	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-251	4-Tz	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-252	4-Tz	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-253	4-Tz	H	H	H	1-Np	cHx
2-254	4-Tz	H	H	H	1-Np	Bz
2-255	4-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-256	4-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-257	4-Tz	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np) Me
2-258	2-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-259	3-(2-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-260	3-(3-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-261	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-262	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	1-Np	cHx

2-263	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-264	4-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-265	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-266	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-267	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	cHx
2-268	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-269	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-270	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	cHx
2-271	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-272	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-273	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	cHx
2-274	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-275	3-[3-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-276	3-[3-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-277	3-[3-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-278	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-279	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-280	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-281	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-282	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-283	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-284	4-[2-(2-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-285	4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-286	4-[2-(2-F-Ph) Ph] SO ₂ HNOC	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me

2-287	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-288	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-289	2-MeSO ₂	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-290	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-291	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	Bz
2-292	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph)Me
2-293	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph)Me
2-294	2-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np)Me
2-295	3-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-296	3-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-297	3-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph)Me
2-298	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-299	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-300	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-301	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	Bz
2-302	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph)Me
2-303	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph)Me
2-304	4-MeSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np)Me
2-305	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-306	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-307	2-EtSO ₂	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-308	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-309	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	Bz
2-310	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph)Me
2-311	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph)Me
2-312	2-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np)Me

2-313	3-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-314	3-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-315	3-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-316	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-317	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-318	4-EtSO ₂	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-319	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-320	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-321	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (4-Br-Ph) Me
2-322	4-EtSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (1-Np) Me
2-323	2-PrSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-324	4-PrSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-325	2-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-326	2-BuSO ₂	H	H	H	1-(5-Me-Np)	cHx
2-327	2-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-328	2-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-329	2-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (4-Br-Ph) Me
2-330	2-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (1-Np) Me
2-331	3-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-332	3-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-333	3-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-334	4-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-335	4-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-336	4-BuSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH (Ph) Me
2-337	2-PhSO ₂	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-338	2-PhSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx

2-339	2-PhSO ₂	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-340	3-PhSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-341	4-PhSO ₂	H	H	H	1-Np	cHx
2-342	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-343	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	cHx
2-344	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-345	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-346	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	cHx
2-347	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-348	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	1-Et-Pn
2-349	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	2-Et-Hx
2-350	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	cHx
2-351	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	Bz
2-352	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-353	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-(5-Me-Np)	-CH(Ph) Me
2-354	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-355	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(1-Np) Me
2-356	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-357	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-358	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-359	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-360	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-361	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-362	2-MeSO	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-363	2-EtSO	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me
2-364	3-MeSO	H	H	H	1-Np	-CH(Ph) Me

2-365	4-MeSO	H	H	H	1-Np	-CH(Ph)Me
2-366	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-367	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-368	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-369	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-370	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	Bz
2-371	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-372	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph)Me
2-373	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np)Me
2-374	2-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-375	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-376	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-377	2-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-378	3-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-379	3-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-380	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-381	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-382	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-383	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	Bz
2-384	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-385	4-(3-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-386	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-387	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-388	4-(4-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-389	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-390	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx

2-391	2-(2-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-392	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-393	4-(4-EtSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Np	cHx
2-394	2-Tz	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-395	2-Tz	H	H	H	2-Np	cHx
2-396	2-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-397	2-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-398	2-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-399	3-Tz	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-400	3-Tz	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-401	3-Tz	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-402	3-Tz	H	H	H	2-Np	cHx
2-403	3-Tz	H	H	H	2-Np	Bz
2-404	3-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-405	3-Tz	H	H	H	2-Np-	-CH(4-Br-Ph) Me
2-406	3-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-407	4-Tz	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-408	4-Tz	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-409	4-Tz	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-410	4-Tz	H	H	H	2-Np	cHx
2-411	4-Tz	H	H	H	2-Np	Bz
2-412	4-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-413	4-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-414	4-Tz	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-415	2-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-416	3-(2-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me

2-417	3-(3-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-418	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-419	3-(4-Tol) SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	cHx
2-420	3-(4-Tol) SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-421	4-(4-Tol) SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-422	2-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-423	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-424	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	cHx
2-425	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-426	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-427	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	cHx
2-428	3-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-429	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-430	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	cHx
2-431	3-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-432	3-[3-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-433	3-[3-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-434	3-[3-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-435	3-[4-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-436	3-[4-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-437	3-[4-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-438	4-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-439	4-[2-(3-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-440	4-[2-(4-Tol) Ph] SO ₂ HNOc	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-441	4-[2-(2-Et-Ph) Ph] SO ₂ HNOc					
		H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me

2-442 4-[2-(2-MeO-Ph) Ph] SO₂HNO₂

H H H 2-Np -CH(Ph) Me

2-443 4-[2-(2-F-Ph) Ph] SO₂HNO₂ H H H 2-Np -CH(Ph) Me2-444 2-MeSO₂ H H H 2-Np 1-Et-Pn2-445 2-MeSO₂ H H H 2-Np 2-Et-Hx2-446 2-MeSO₂ H H H 2-(5-Me-Np) cHx2-447 2-MeSO₂ H H H 2-Np cHx2-448 2-MeSO₂ H H H 2-Np Bz2-449 2-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(Ph) Me2-450 2-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(4-Br-Ph) Me2-451 2-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(1-Np) Me2-452 3-MeSO₂ H H H 2-Np 1-Et-Pn2-453 3-MeSO₂ H H H 2-Np cHx2-454 3-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(Ph) Me2-455 4-MeSO₂ H H H 2-Np 1-Et-Pn2-456 4-MeSO₂ H H H 2-Np 2-Et-Hx2-457 4-MeSO₂ H H H 2-Np cHx2-458 4-MeSO₂ H H H 2-Np Bz2-459 4-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(Ph) Me2-460 4-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(4-Br-Ph) Me2-461 4-MeSO₂ H H H 2-Np -CH(1-Np) Me2-462 2-EtSO₂ H H H 2-Np 1-Et-Pn2-463 2-EtSO₂ H H H 2-Np 2-Et-Hx2-464 2-EtSO₂ H H H 2-(5-Me-Np) cHx2-465 2-EtSO₂ H H H 2-Np cHx2-466 2-EtSO₂ H H H 2-Np Bz

2-467	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-468	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-469	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-470	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-471	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-472	3-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-473	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-474	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-475	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-476	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-477	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-478	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-479	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-480	2-PrSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-481	4-PrSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-482	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-483	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(5-Me-Np)	cHx
2-484	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-485	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-486	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(4-Br-Ph) Me
2-487	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(1-Np) Me
2-488	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-489	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-490	3-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH(Ph) Me
2-491	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-492	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx

2-493	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-494	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-495	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-496	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-497	3-PhSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-498	4-PhSO ₂	H	H	H	2-Np	cHx
2-499	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-500	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	cHx
2-501	2-(2-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-502	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-503	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	cHx
2-504	2-(3-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-505	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	1-Et-Pn
2-506	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	2-Et-Hx
2-507	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	cHx
2-508	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	Bz
2-509	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-510	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-(5-Me-Np)	-CH (Ph) Me
2-511	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (4-Br-Ph) Me
2-512	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (1-Np) Me
2-513	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-514	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-515	2-(4-Et-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-516	2-(4-MeO-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-517	2-(4-F-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me
2-518	2-(4-Cl-Ph) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Np	-CH (Ph) Me

142

2-519	2-MeSO	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-520	2-EtSO	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-521	3-MeSO	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me
2-522	4-MeSO	H	H	H	2-Np	-CH(Ph)Me

【表 3】

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^{5c}	R ⁶
3-1	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-2	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-3	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-4	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-5	3-Tz	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-6	3-Tz	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-7	3-Tz	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-8	3-Tz	H	H	H	2-(4-Me-Pyrr)	-CH(Ph)Me
3-9	3-Tz	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-10	3-Tz	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-11	3-Tz	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-12	3-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Pyrr)	-CH(Ph)Me
3-13	4-Tz	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-14	4-Tz	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-15	4-Tz	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-16	4-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Pyrr)	-CH(Ph)Me
3-17	3-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me

3-18	3-(4-Tol)SO ₂ HNOC	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-19	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC					
		H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-20	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC					
		H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-21	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-22	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-23	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Pyrr)	cHx
3-24	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-25	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-26	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-27	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Pyrr)	cHx
3-28	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-29	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-30	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-31	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-32	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-33	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-34	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-35	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-36	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-37	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Pyrr)	cHx
3-38	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-39	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-40	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-41	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Pyrr)	cHx

3-42	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-43	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-44	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-45	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-46	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-47	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-48	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-49	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-50	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-51	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-52	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-53	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-54	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-55	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	1-Et-Pn
3-56	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-57	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-58	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	1-Et-Pn
3-59	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-60	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-61	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Pyrr	tBu
3-62	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Pyrr	tBu
3-63	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-64	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Pyrr	-CH(Ph)Me
3-65	2-MeO	H	H	H	2-Pyrr	cHx
3-66	2-MeO	H	H	H	3-Pyrr	cHx
3-67	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	2-Hep

3-68	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	cHx
3-69	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-70	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(4-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-71	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	2-Hep
3-72	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	cHx
3-73	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-74	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(4-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-75	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	2-Hep
3-76	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	cHx
3-77	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-78	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(4-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-79	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	2-Hep
3-80	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	cHx
3-81	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-82	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(4-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-83	3-Tz	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-84	3-Tz	H	H	H	2-Thi	cHx
3-85	3-Tz	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-86	3-Tz	H	H	H	2-(4-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-87	3-Tz	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-88	3-Tz	H	H	H	3-Thi	cHx
3-89	3-Tz	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-90	3-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-91	4-Tz	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-92	4-Tz	H	H	H	3-Thi	cHx
3-93	4-Tz	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me

3-94	4-Tz	H	H	H	3-(5-Me-Thi)	-CH(Ph)Me
3-95	3-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-96	3-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-97	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-98	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-99	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-100	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-101	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Thi)	cHx
3-102	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-103	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-104	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-105	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Thi)	cHx
3-106	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-107	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-108	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-109	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-110	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-111	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-112	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-113	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-114	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-115	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Thi)	cHx
3-116	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-117	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn

3-118	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-119	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Thi)	cHx
3-120	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-121	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-122	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-123	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-124	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-125	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-126	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-127	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-128	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-129	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-130	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-131	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-132	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-133	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn
3-134	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-135	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thi	-CH(Ph)Me
3-136	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-137	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-138	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thi	-CH(Ph)Me
3-139	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Thi	tBu
3-140	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Thi	tBu
3-141	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Thi	cHx
3-142	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Thi	cHx
3-143	2-MeSO	H	H	H	2-Thi	1-Et-Pn

148

3-144	2-MeSO	H	H	H	2-Thi	cHx
3-145	2-MeSO	H	H	H	2-Thi	-CH (Ph) Me
3-146	2-MeSO	H	H	H	3-Thi	1-Et-Pn
3-147	2-MeSO	H	H	H	3-Thi	cHx
3-148	2-MeSO	H	H	H	3-Thi	-CH (Ph) Me
3-149	4-MeSO	H	H	H	2-Thi	cHx
3-150	4-MeSO	H	H	H	3-Thi	cHx
3-151	2-EtSO	H	H	H	2-Thi	cHx
3-152	2-EtSO	H	H	H	3-Thi	cHx
3-153	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Thi	-CH (Ph) Me
3-154	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Thi	-CH (Ph) Me
3-155	4-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Thi	-CH (Ph) Me
3-156	4-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Thi	-CH (Ph) Me
3-157	3-Tz	H	H	H	2-Thi	-CH (4-Br-Ph) Me
3-158	4-Tz	H	H	H	3-Thi	-CH (4-Br-Ph) Me
3-159	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-160	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-161	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-162	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-163	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-164	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-165	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH (Ph) Me
3-166	3-Tz	H	H	H		-CH (Ph) Me
R ^{5c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-Thi)						
3-167	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-168	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx

3-169	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-170	3-Tz	H	H	H		-CH(Ph)Me
					R ^{6c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-Thi)	
3-171	4-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-172	4-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-173	4-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-174	4-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
					R ^{6c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-Thi)	
3-175	3-(4-Tol)SO ₂ HNOC	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-176	3-(4-Tol)SO ₂ HNOC	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-177	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC					
		H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-178	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOC					
		H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-179	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-180	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-181	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{6c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-Thi)	
3-182	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-183	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-184	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-185	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{6c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-Thi)	
3-186	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-187	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-188	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx

150

3-189	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-190	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-191	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-192	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-193	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-194	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-195	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx

R^{5c}=2-(1,1-dioxo-4-Me-Thi)

3-196	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-197	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-198	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-199	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx

R^{5c}=3-(1,1-dioxo-5-Me-Thi)

3-200	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-201	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-202	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-203	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-204	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-205	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-206	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-207	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-208	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-209	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me
3-210	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-211	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-212	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph)Me

3-213	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-214	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-215	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph) Me
3-216	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	1-Et-Pn
3-217	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	cHx
3-218	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph) Me
3-219	2-PhSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	tBu
3-220	2-PhSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	tBu
3-221	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph) Me
3-222	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(Ph) Me
3-223	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(4-Br-Ph) Me
3-224	4-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-Thi)	-CH(4-Br-Ph) Me
3-225	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	2-Hep
3-226	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-227	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	-CH(Ph) Me
3-228	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	2-Hep
3-229	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-230	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	-CH(Ph) Me
3-231	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	2-Hep
3-232	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-233	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Thiz	-CH(Ph) Me
3-234	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	2-Hep
3-235	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-236	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Thiz	-CH(Ph) Me
3-237	3-Tz	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-238	3-Tz	H	H	H	2-Thiz	cHx

3-239	3-Tz	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-240	3-Tz	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-241	3-Tz	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-242	3-Tz	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-243	4-Tz	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-244	4-Tz	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-245	4-Tz	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-246	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-247	3-(4-Tol) SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-248	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-249	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-250	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-251	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-252	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-253	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-254	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-255	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-256	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-257	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-258	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-259	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-260	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-261	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-262	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn

3-263	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-264	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-265	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-266	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-267	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-268	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-269	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-270	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-271	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-272	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-273	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-274	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-275	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-276	2-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-277	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-278	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-279	2-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-280	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	1-Et-Pn
3-281	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	cHx
3-282	4-BuSO ₂	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-283	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	1-Et-Pn
3-284	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	cHx
3-285	4-BuSO ₂	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-286	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Thiz	tBu
3-287	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Thiz	tBu
3-288	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me

154

3-289	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-290	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Thiz	-CH (Ph) Me
3-291	4-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Thiz	-CH (Ph) Me
3-292	3-Tz	H	H	H	2-Thiz	-CH (4-Br-Ph) Me
3-293	4-Tz	H	H	H	3-Thiz	-CH (4-Br-Ph) Me
3-294	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Ind	cHx
3-295	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Ind	cHx
3-296	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Ind	cHx
3-297	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Ind	cHx
3-298	3-Tz	H	H	H	2-Ind	-CH (Ph) Me
3-299	3-Tz	H	H	H	3-Ind	-CH (Ph) Me
3-300	4-Tz	H	H	H	2-Ind	1-Et-Pn
3-301	4-Tz	H	H	H	3-Ind	1-Et-Pn
3-302	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-Ind	-CH (Ph) Me
3-303	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	3-Ind	-CH (Ph) Me
3-304	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	2-Ind	-CH (Ph) Me
3-305	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	3-Ind	-CH (Ph) Me
3-306	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	1-Et-Pn
3-307	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	cHx
3-308	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{5c} =2-(4-Me-Ind)	
3-309	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	-CH (Ph) Me
3-310	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	1-Et-Pn
3-311	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	cHx

3-312	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{5c} =3-(5-Me-Ind)	
3-313	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	-CH(Ph)Me
3-314	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	1-Et-Pn
3-315	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	cHx
3-316	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Ind	-CH(Ph)Me
3-317	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	1-Et-Pn
3-318	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	cHx
3-319	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Ind	-CH(Ph)Me
3-320	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	1-Et-Pn
3-321	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	cHx
3-322	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{5c} =2-(4-Me-Ind)	
3-323	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	-CH(Ph)Me
3-324	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	1-Et-Pn
3-325	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	cHx
3-326	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx
					R ^{5c} =3-(5-Me-Ind)	
3-327	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	-CH(Ph)Me
3-328	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	1-Et-Pn
3-329	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	cHx
3-330	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Ind	-CH(Ph)Me
3-331	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	1-Et-Pn
3-332	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	cHx
3-333	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Ind	-CH(Ph)Me
3-334	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Ind	tBu

3-335	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Ind	tBu
3-336	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Ind	-CH(Ph)Me
3-337	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Ind	-CH(Ph)Me
3-338	3-Tz	H	H	H	2-Ind	-CH(4-Br-Ph)Me
3-339	4-Tz	H	H	H	3-Ind	-CH(4-Br-Ph)Me
3-340	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-BThi	cHx
3-341	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-BThi	cHx
3-342	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-BThi	cHx
3-343	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-BThi	cHx
3-344	3-Tz	H	H	H	2-BThi	-CH(Ph)Me
3-345	3-Tz	H	H	H	3-BThi	-CH(Ph)Me
3-346	4-Tz	H	H	H	2-BThi	1-Et-Pn
3-347	4-Tz	H	H	H	3-BThi	1-Et-Pn
3-348	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-BThi	-CH(Ph)Me
3-449	3-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-BThi	-CH(Ph)Me
3-350	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOCHN					
		H	H	H	2-BThi	-CH(Ph)Me
3-351	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOCHN					
		H	H	H	3-BThi	-CH(Ph)Me
3-352	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	1-Et-Pn
3-353	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	cHx
3-354	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BThi)	cHx
3-355	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	-CH(Ph)Me
3-356	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	1-Et-Pn
3-357	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	cHx
3-358	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BThi)	cHx

3-359	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	-CH (Ph) Me
3-360	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	1-Et-Pn
3-361	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	cHx
3-362	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThi	-CH (Ph) Me
3-363	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	1-Et-Pn
3-364	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	cHx
3-365	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BThi	-CH (Ph) Me
3-366	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	1-Et-Pn
3-367	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	cHx
3-368	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BThi)	cHx
3-369	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	-CH (Ph) Me
3-370	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	1-Et-Pn
3-371	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	cHx
3-372	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BThi)	cHx
3-373	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	-CH (Ph) Me
3-374	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	1-Et-Pn
3-375	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	cHx
3-376	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThi	-CH (Ph) Me
3-377	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	1-Et-Pn
3-378	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	cHx
3-379	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThi	-CH (Ph) Me
3-380	2-PhSO ₂	H	H	H	2-BThi	tBu
3-381	2-PhSO ₂	H	H	H	3-BThi	tBu
3-382	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-BThi	-CH (Ph) Me
3-383	2-(4-Tol) SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-BThi	-CH (Ph) Me
3-384	3-Tz	H	H	H	2-BThi	-CH (4-Br-Ph) Me

3-385	4-Tz	H	H	H	3-BThi	-CH (4-Br-Ph) Me
3-386	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	2-Hep
3-387	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-388	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-389	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H		-CH (Ph) Me
					R ^{6c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)	
3-390	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	2-Hep
3-391	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-392	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-393	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H		-CH (Ph) Me
					R ^{6c} =3-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)	
3-394	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	2-Hep
3-395	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-396	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-397	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H		-CH (Ph) Me
					R ^{6c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)	
3-398	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	2-Hep
3-399	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-400	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-401	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H		-CH (Ph) Me
					R ^{6c} =3-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)	
3-402	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-403	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-404	3-Tz	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (PH) Me
3-405	3-Tz	H	H	H		-CH (PH) Me
					R ^{6c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)	

3-406	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-407	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-408	3-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-409	3-Tz	H	H	H		-CH (Ph) Me
R ^{5c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-BThi)						
3-410	4-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-411	4-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-412	4-Tz	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-413	4-Tz	H	H	H		-CH (Ph) Me
R ^{5c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-BThi)						
3-414	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-415	3-(4-Tol) SO ₂ HNOC	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-416	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-417	3-[2-(2-Tol) Ph] SO ₂ HNOC					
		H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-418	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-419	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-420	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
R ^{5c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)						
3-421	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me
3-422	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-423	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-424	2-MeSO ₂	H	H	H		cHx
R ^{5c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-BThi)						
3-425	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH (Ph) Me

160

3-426	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-427	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-428	4-MeSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-429	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-430	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-431	4-MeSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-432	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-433	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-434	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx
R ^{5c} =2-(1,1-dioxo-4-Me-BThi)						
3-435	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-436	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-437	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-438	2-EtSO ₂	H	H	H		cHx
R ^{5c} =3-(1,1-dioxo-5-Me-BThi)						
3-439	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-440	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-441	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-442	4-EtSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-443	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-444	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-445	4-EtSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-446	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-447	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-448	2-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-449	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn

3-450	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-451	2-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-452	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-453	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-454	4-BuSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-455	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	1-Et-Pn
3-456	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	cHx
3-457	4-BuSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-458	2-PhSO ₂	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	tBu
3-459	2-PhSO ₂	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	tBu
3-460	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-461	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-462	4-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-463	4-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-(1,1-dioxo-BThi)	-CH(Ph)Me
3-464	3-Tz	H	H	H		-CH(4-Br-Ph)Me
					R ^{5c} =2-(1,1-dioxo-BThi)	
3-465	4-Tz	H	H	H		-CH(4-Br-Ph)Me
					R ^{5c} =2-(1,1-dioxo-BThi)	
3-466	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-467	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-BThiz	cHx
3-468	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-469	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-BThiz	cHx
3-470	3-Tz	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-471	3-Tz	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-472	4-Tz	H	H	H	2-BThiz	1-Et-Pn
3-473	4-Tz	H	H	H	3-BThiz	1-Et-Pn

3-474	3-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-475	3-(4-Tol)SO ₂ HNO ₂	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-476	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-477	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNO ₂					
		H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-478	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	1-Et-Pn
3-479	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-480	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BThiz)	cHx
3-481	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-482	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThiz	1-Et-Pn
3-483	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThiz	cHx
3-484	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BThiz)	cHx
3-485	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-486	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	1-Et-Pn
3-487	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-488	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-489	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BThiz	1-Et-Pn
3-490	4-MeSO ₂	K	H	H	3-BThiz	cHx
3-491	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-492	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	1-Et-Pn
3-493	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-494	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BThiz)	cHx
3-495	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-496	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	1-Et-Pn
3-497	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	cHx

3-498	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BThiz)	cHx
3-499	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-500	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	1-Et-Pn
3-501	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	cHx
3-502	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-503	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	1-Et-Pn
3-504	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	cHx
3-505	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-506	2-PhSO ₂	H	H	H	2-BThiz	tBu
3-507	2-PhSO ₂	H	H	H	3-BThiz	tBu
3-508	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-BThiz	-CH(Ph)Me
3-509	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-BThiz	-CH(Ph)Me
3-510	3-Tz	H	H	H	2-BThiz	-CH(4-Br-Ph)Me
3-511	4-Tz	H	H	H	3-BThiz	-CH(4-Br-Ph)Me
3-512	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Oxa	cHx
3-513	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-514	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-Oxa	cHx
3-515	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-516	3-Tz	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-517	3-Tz	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-518	4-Tz	H	H	H	2-Oxa	1-Et-Pn
3-519	4-Tz	H	H	H	3-Oxa	1-Et-Pn
3-520	3-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-521	3-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-522	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me

3-523 3-[2-(2-Tol)Ph]SO₂HNO₂

		H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-524	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	1-Et-Pn
3-525	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	cHx
3-526	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Oxa)	cHx
3-527	2-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-528	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	1-Et-Pn
3-529	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-530	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Oxa)	cHx
3-531	2-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-532	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	1-Et-Pn
3-533	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	cHx
3-534	4-MeSO ₂	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-535	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	1-Et-Pn
3-536	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-537	4-MeSO ₂	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-538	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	1-Et-Pn
3-539	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	cHx
3-540	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-Oxa)	cHx
3-541	2-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-542	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	1-Et-Pn
3-543	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-544	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-Oxa)	cHx
3-545	2-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-546	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	1-Et-Pn
3-547	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	cHx

165

3-548	4-EtSO ₂	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-549	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	1-Et-Pn
3-550	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	cHx
3-551	4-EtSO ₂	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-552	2-PhSO ₂	H	H	H	2-Oxa	tBu
3-553	2-PhSO ₂	H	H	H	3-Oxa	tBu
3-554	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-Oxa	-CH(Ph)Me
3-555	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-Oxa	-CH(Ph)Me
3-556	3-Tz	H	H	H	2-Oxa	-CH(4-Br-Ph)Me
3-557	4-Tz	H	H	H	3-Oxa	-CH(4-Br-Ph)Me
3-558	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-B0xa	cHx
3-559	2-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-B0xa	cHx
3-560	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	2-B0xa	cHx
3-561	4-(2-MeSO ₂ -Ph)	H	H	H	3-B0xa	cHx
3-562	3-Tz	H	H	H	2-B0xa	-CH(Ph)Me
3-563	3-Tz	H	H	H	3-B0xa	-CH(Ph)Me
3-564	4-Tz	H	H	H	2-B0xa	1-Et-Pn
3-565	4-Tz	H	H	H	3-B0xa	1-Et-Pn
3-566	3-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-B0xa	-CH(Ph)Me
3-567	3-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-B0xa	-CH(Ph)Me
3-568	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOCHN					
		H	H	H	2-B0xa	-CH(Ph)Me
3-569	3-[2-(2-Tol)Ph]SO ₂ HNOCHN					
		H	H	H	3-B0xa	-CH(Ph)Me
3-570	2-MeSO ₂	H	H	H	2-B0xa	1-Et-Pn
3-571	2-MeSO ₂	H	H	H	2-B0xa	cHx

3-572	2-MeSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BOxa)	cHx
3-573	2-MeSO ₂	H	H	H	2-BOxa	-CH(Ph) Me
3-574	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	1-Et-Pn
3-575	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	cHx
3-576	2-MeSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BOxa)	cHx
3-577	2-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	-CH(Ph) Me
3-578	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BOxa	1-Et-Pn
3-579	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BOxa	cHx
3-580	4-MeSO ₂	H	H	H	2-BOxa	-CH(Ph) Me
3-581	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	1-Et-Pn
3-582	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	cHx
3-583	4-MeSO ₂	H	H	H	3-BOxa	-CH(Ph) Me
3-584	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	1-Et-Pn
3-585	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	cHx
3-586	2-EtSO ₂	H	H	H	2-(4-Me-BOxa)	cHx
3-587	2-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	-CH(Ph) Me
3-588	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	1-Et-Pn
3-589	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	cHx
3-590	2-EtSO ₂	H	H	H	3-(5-Me-BOxa)	cHx
3-591	2-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	-CH(Ph) Me
3-592	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	1-Et-Pn
3-593	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	cHx
3-594	4-EtSO ₂	H	H	H	2-BOxa	-CH(Ph) Me
3-595	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	1-Et-Pn
3-596	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	cHx
3-597	4-EtSO ₂	H	H	H	3-BOxa	-CH(Ph) Me

167

3-598	2-PhSO ₂	H	H	H	2-BOxa	tBu
3-599	2-PhSO ₂	H	H	H	3-BOxa	tBu
3-600	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	2-BOxa	-CH(Ph)Me
3-601	2-(4-Tol)SO ₂ HNOCHN	H	H	H	3-BOxa	-CH(Ph)Me
3-602	3-Tz	H	H	H	2-BOxa	-CH(4-Br-Ph)Me
3-603	4-Tz	H	H	H	3-BOxa	-CH(4-Br-Ph)Me

また、上記表において、一般式 (I) を有するベンジルアミン類において好適な化合物としては、

化合物番号 1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-87、1-125、1-176、1-236、1-266、1-366、1-367、1-410、1-417、1-418、1-427、1-442、1-444、1-447、1-461、1-467、1-489、1-503、1-510、1-518、1-525、1-527、1-529、1-530、1-550、1-568、1-572、1-575、1-586、1-587、1-593、1-616、1-617、1-633、1-637、1-638、1-639、1-640、1-641、1-643、1-654、1-655、1-665、1-667、1-669、1-670、1-675、1-677、1-679、1-687、1-696、1-705、1-707、1-709、1-710、1-711、1-712、1-767、1-768、1-769、1-771、1-775、1-782、1-784、1-786、1-802、1-811、1-815、1-816、1-820、1-843、1-847、1-853、1-873、1-875、1-876、1-878、1-910、1-927、1-931、1-945、1-946、1-952、1-994、1-1014、1-1019、1-1028、1-1035、1-1077、1-1097、1-1110、1-1160、1-1172、1-1174、1-1177、1-1180、1-1193、1-1195、1-1196、1-1202、1-1264、1-1267、1-1270、1-1285、1-1346、1-1387、1-1456、1-1458、1-1461、1-1477、1-1512、1-1522、1-1609、1-1645、1-1649、1-1697、1-1739、1-1754、1-1769、1-1775、1-1780、1-1782、2-15、2-18、2-21、2-24、2-28、2-31、2-32、2-94、2-98、2-119、2-122、2-131、2-136、2-140、2-144、2-147、2-152、2-214、2-220、2-229、2-242、2-247、2-248、2-255、2-260、2-274、2-276、2-290、2-29

7、2-311、2-315、2-320、2-339、2-341、2-344、2-357、2-360、2-366、2-375、2-377、2-399、2-404、2-405、2-406、2-408、2-412、2-422、2-426、2-447、2-449、2-454、2-472、2-499、2-504、3-7、3-71、3-77、3-83、3-86、3-89、3-90、3-91、3-100、3-120、3-132、3-135、3-141、3-144、3-153、3-163、3-165、3-171、3-173、3-196、3-215、3-223、3-228、3-237、3-242、3-243、3-245、3-263、3-270、3-289、3-298、3-301、3-306、3-319、3-323、3-338、3-344、3-347、3-362、3-402、3-410、3-423、3-437、3-451、3-453、3-456、3-464、3-466、3-470、3-488、3-510、3-562 および3-573 の化合物をあげることができ、

更に好適な化合物として、

化合物番号1-410、1-417、1-427、1-447、1-489、1-510、1-530、1-550、1-568、1-572、1-587、1-593、1-616、1-617、1-640、1-669、1-675、1-677、1-679、1-687、1-696、1-711、1-712、1-786、1-802、1-811、1-815、1-816、1-820、1-843、1-847、1-853、1-931、1-945、1-1019、1-1035、1-1077、1-1097、1-1160、1-1177、1-1180、1-1202、1-1267、1-1461、1-1512、1-1522、1-1645、1-1739、1-1754、2-15、2-18、2-21、2-24、2-242、2-247、2-255、2-320、2-344、2-399、2-404、2-405、2-406、2-408、2-412、2-422、2-426、2-449、2-504、3-7、3-71、3-77、3-83、3-89、3-91、3-141、3-153、3-223、3-237、3-242、3-245、3-298、3-338、3-344、3-347、3-402、3-410、3-423、3-464、3-488、3-510、3-562 および3-573 の化合物をあげることができ、

特に好適な化合物としては、

化合物番号1-417 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[6-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-447 : N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H-

テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-489 : N-(1-フェニルエチル) - {フェニル-[3-(1H-
テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-530 : N-(1-エチルペンチル) - {フェニル-[4-(1H-
テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-572 : N-(1-フェニルエチル) - {フェニル-[4-(1H-
テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-587 : N-(1-フェニルエチル) - {(4-メトキシフェニル)
-[4-(1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-640 : N-(1-フェニルエチル) - [フェニル-(3-メチルス
ルホニルカルバモイルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-679 : N-(1-エチルペンチル) - [フェニル-(3-N-トシ
ルカルバモイルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-687 : N-シクロヘキシル-[フェニル-(3-N-トシルカルバ
モイルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-696 : N-(1-フェニルエチル) - [フェニル-(3-N-トシ
ルカルバモイルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-802 : N-(1-フェニルエチル) - {フェニル-[3-(2-(
2-メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} ア
ミン、

化合物番号1-815 : N-(1-フェニルエチル) - {フェニル-[3-(2-(
3-メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} ア
ミン、

化合物番号1-820 : N-(1-フェニルエチル) - {フェニル-[3-(2-(
4-メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} ア
ミン、

化合物番号1-847 : N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (2 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-853 : N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (4 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

化合物番号1-1177 : N - (インダン - 1 - イル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1180 : N - (2 - フェニルエチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1512 : N - t e r t - ブチル - [フェニル - (2 - フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1739 : N - {2 - [1 - フェニル - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

化合物番号1-1754 : N - {2 - [1 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

化合物番号2-15 : N - (1 - エチルペンチル) - {2 - インデニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号2-24 : N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インデニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号2-242 : N - (1 - エチルペンチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号2-247 : N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号2-255 : N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号3-223 : N - [1 - (4 - プロモフェニル) エチル] - { (1 , 1 - ジオキソチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-237 : N - (1 - エチルベンチル) - { 2 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-242 : N - (1 - フェニルエチル) - { 3 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-298 : N - (1 - フェニルエチル) - { 2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-338 : N - [1 - (4 - プロモフェニル) エチル] - { 2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-423 : N - シクロヘキシル - [(1 , 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 3 - イル) - (2 - メチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号3-464 : N - [1 - (4 - プロモフェニル) エチル] - { (1 , 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-510 : N - [1 - (4 - プロモフェニル) エチル] - { 2 - ベンゾチアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミンおよび

化合物番号3-562 : N - (1 - フェニルエチル) - { 3 - ベンゾオキサゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン

の化合物をあげることができる。

また、上記表において、本発明の胆汁酸トランスポーター阻害剤の有効成分として含有される、一般式 (I I) を有するベンジルアミン類において好適な化合物としては、

化合物番号1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-87、1-125、1-176、1-236、1-

266 、 1-366 、 1-367 、 1-410 、 1-417 、 1-418 、 1-427 、 1-442 、 1-444 、 1-447 、 1-461 、 1-467 、 1-489 、 1-503 、 1-510 、 1-518 、 1-525 、 1-527 、 1-529 、 1-530 、 1-550 、 1-568 、 1-572 、 1-575 、 1-586 、 1-587 、 1-593 、 1-616 、 1-617 、 1-633 、 1-637 、 1-638 、 1-639 、 1-640 、 1-641 、 1-643 、 1-654 、 1-655 、 1-665 、 1-667 、 1-669 、 1-670 、 1-675 、 1-677 、 1-679 、 1-687 、 1-696 、 1-705 、 1-707 、 1-709 、 1-710 、 1-711 、 1-712 、 1-767 、 1-768 、 1-769 、 1-771 、 1-775 、 1-782 、 1-784 、 1-786 、 1-802 、 1-811 、 1-815 、 1-816 、 1-820 、 1-843 、 1-847 、 1-853 、 1-873 、 1-875 、 1-876 、 1-878 、 1-879 、 1-881 、 1-884 、 1-910 、 1-927 、 1-931 、 1-945 、 1-946 、 1-952 、 1-967 、 1-968 、 1-969 、 1-972 、 1-975 、 1-994 、 1-1014 、 1-1019 、 1-1028 、 1-1035 、 1-1051 、 1-1053 、 1-1055 、 1-1067 、 1-1068 、 1-1077 、 1-1097 、 1-1110 、 1-1133 、 1-1135 、 1-1138 、 1-1150 、 1-1153 、 1-1160 、 1-1172 、 1-1174 、 1-1177 、 1-1180 、 1-1193 、 1-1195 、 1-1196 、 1-1202 、 1-1219 、 1-1220 、 1-1222 、 1-1237 、 1-1264 、 1-1267 、 1-1270 、 1-1285 、 1-1305 、 1-1318 、 1-1346 、 1-1387 、 1-1392 、 1-1400 、 1-1409 、 1-1410 、 1-1411 、 1-1412 、 1-1456 、 1-1458 、 1-1461 、 1-1477 、 1-1512 、 1-1522 、 1-1609 、 1-1645 、 1-1649 、 1-1697 、 1-1739 、 1-1754 、 1-1769 、 1-1775 、 1-1780 、 1-1782 、 2-15 、 2-18 、 2-21 、 2-24 、 2-28 、 2-31 、 2-32 、 2-94 、 2-98 、 2-119 、 2-122 、 2-131 、 2-136 、 2-140 、 2-144 、 2-147 、 2-152 、 2-214 、 2-220 、 2-229 、 2-242 、 2-247 、 2-248 、 2-255 、 2-260 、 2-274 、 2-276 、 2-290 、 2-297 、 2-311 、 2-315 、 2-320 、 2-339 、 2-341 、 2-344 、 2-357 、 2-360 、 2-366 、 2-375 、 2-377 、 2-399 、 2-404 、 2-405 、 2-406 、 2-408 、 2-412 、 2-422 、 2-426 、 2-447 、 2-449 、 2-454 、 2-472 、 2-499 、 2-504 、 3-7 、 3-71 、 3-77 、 3-83 、 3-86 、 3-89 、 3-90 、 3-91 、 3-100 、 3-120 、 3-132 、 3-135 、 3-141 、 3-144 、 3-153 、 3-163 、 3-165 、 3-171 、 3-173 、 3-196 、 3-201 、 3-215 、 3-223 、 3-228 、 3-237 、 3-242 、 3-243 、 3-245 、 3-250 、 3-263 、 3-270 、 3-289 、 3-298 、 3-301 、 3-306 、 3-319 、 3-32

3、3-338、3-344、3-347、3-352、3-362、3-374、3-402、3-410、3-423、3-437、3-451、3-453、3-456、3-464、3-466、3-470、3-488、3-510、3-562 および3-573 の化合物をあげることができ、

更に好適な化合物として、

化合物番号1-410、1-417、1-427、1-447、1-489、1-510、1-530、1-550、1-568、1-572、1-587、1-593、1-616、1-617、1-640、1-669、1-675、1-677、1-679、1-687、1-696、1-711、1-712、1-786、1-802、1-811、1-815、1-816、1-820、1-843、1-847、1-853、1-879、1-881、1-884、1-931、1-945、1-1019、1-1035、1-1077、1-1097、1-1133、1-1135、1-1138、1-1150、1-1160、1-1177、1-1180、1-1202、1-1267、1-1411、1-1412、1-1461、1-1512、1-1522、1-1645、1-1739、1-1754、2-15、2-18、2-21、2-24、2-242、2-247、2-255、2-320、2-344、2-399、2-404、2-405、2-406、2-408、2-412、2-422、2-426、2-449、2-504、3-7、3-71、3-77、3-83、3-89、3-91、3-141、3-153、3-223、3-237、3-242、3-245、3-298、3-338、3-344、3-347、3-402、3-410、3-423、3-464、3-488、3-510、3-562 および3-573 の化合物をあげることができ、

特に好適な化合物としては、

化合物番号1-417 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[6-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-447 : N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-489 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-530 : N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-572 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-587 : N-(1-フェニルエチル)-{(4-メトキシフェニル)-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-640 : N-(1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-メチルスルホニルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

化合物番号1-679 : N-(1-エチルベンチル)-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

化合物番号1-687 : N-シクロヘキシル-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

化合物番号1-696 : N-(1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

化合物番号1-802 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(2-(2-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-815 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(2-(3-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-820 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(2-(4-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-847 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(2-(2-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

化合物番号1-853 : N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(2-(4-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}ア

ミン、

化合物番号1-1138: N - (1 - エチルペンチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1177: N - (インダン - 1 - イル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1180: N - (2 - フェニルエチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1512: N - t e r t - ブチル - [フェニル - (2 - フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号1-1739: N - { 2 - [1 - フェニル - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル } フェニル - N' - トシルウレア、

化合物番号1-1754: N - { 2 - [1 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル } フェニル - N' - トシルウレア、

化合物番号2-15: N - (1 - エチルペンチル) - { 2 - インデニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号2-24: N - (1 - フェニルエチル) - { 2 - インデニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号2-242: N - (1 - エチルペンチル) - { 1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号2-247: N - (1 - フェニルエチル) - { 1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号2-255: N - (1 - フェニルエチル) - { 1 - ナフチル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-223: N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { (1, 1 - ジオキソチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン、

化合物番号3-237 : N - (1 - エチルペンチル) - {2 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号3-242 : N - (1 - フェニルエチル) - {3 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号3-298 : N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号3-338 : N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

化合物番号3-423 : N - シクロヘキシル - [(1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 3 - イル) - (2 - メチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

化合物番号3-464 : N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {(1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

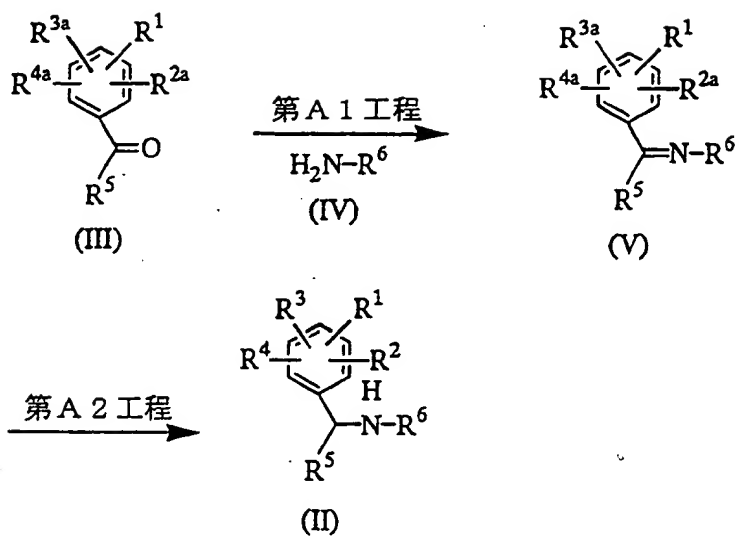
化合物番号3-510 : N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - ベンゾチアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミンおよび

化合物番号3-562 : N - (1 - フェニルエチル) - {3 - ベンゾオキサゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン

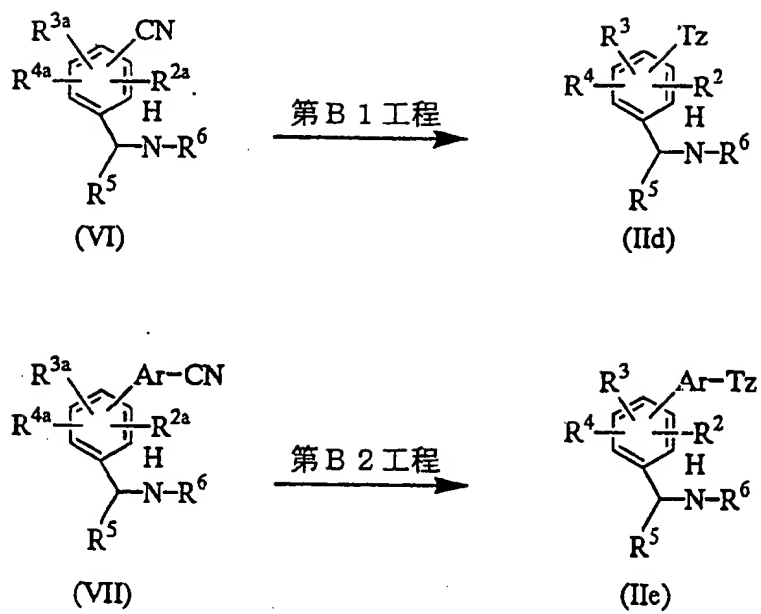
の化合物をあげることができる。

本発明の一般式 (I I) を有する化合物は、以下に示す方法に従って容易に製造できる。また、本発明の一般式 (I) を有する化合物においても、一般式 (I I) を有する化合物を製造する方法と同様の方法で製造することができる。

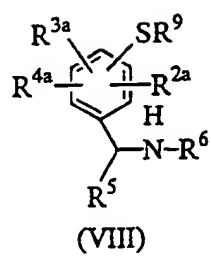
A 法



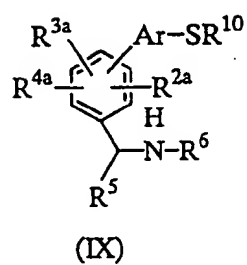
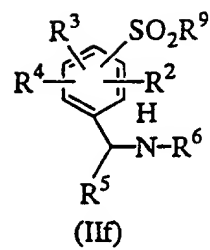
B 法



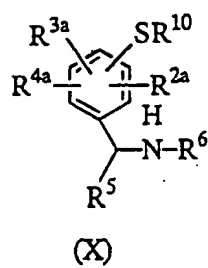
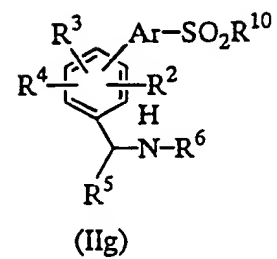
C 法



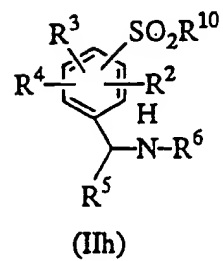
第 C 1 工程



第 C 2 工程



第 C 3 工程



上記の製法において、記載されている化学式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は前述したものと同意義を示し、 R^{2*} 、 R^{3*} および R^{4*} は、それぞれの基に含まれるアミノ基が保護されてもよいアミノ基である他それぞれ R^2 、 R^3 および R^4 と同意義を示し、 R^9 は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^{10} は $C_1 - C_{10}$ アルキル基を示し、 Ar は置換基群 α から選択される基で 1 乃至 2 個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリール基を示し、 Tz は、テトラゾリル基を示す。

アミノ基の保護基は、有機合成化学の分野で通常使用されているものなら、特に制限されず、例えば、 t -ブトキシカルボニル基；ベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジルのような $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシもしくはハロゲンで置換されていてもよいベンジル基；ベンジロキシカルボニル、メチルベンジロキシカルボニル、メトキシベンジロキシカルボニル、フルオロベンジロキシカルボニル、クロロベンジロキシカルボニルのような $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシもしくはハロゲンで置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基；またはクロロアセチル、ブromoアセチル、ヨウドアセチルのようなハロゲノアセチル基；であり、好適には、 t -ブトキシカルボニル基、 p -メトキシベンジル基、 p -メトキシベンジロキシカルボニル基、クロロアセチル基、ブromoアセチル基またはヨウドアセチル基であり、更に好適には、 t -ブトキシカルボニル基または p -メトキシベンジロキシカルボニル基であり、特に好適には、 t -ブトキシカルボニル基である。

A 法は、化合物 (I I) を製造する方法である。

第 A 1 工程は、一般式 (V) を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式 (I I I) を有する化合物と一般式 (I V) を有する化合物またはその酸付加塩（例えば、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩のような鉱酸塩）を反応させること

により行われ、例えば、p-トルエンスルホン酸のような有機スルホン酸を触媒として加熱縮合する方法または四塩化チタンのようなルイス酸を用いて縮合する方法により行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定はされず、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類；ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトンのようなケトン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；である。有機スルホン酸を触媒として加熱縮合する場合、好適には炭化水素類（特に好適にはキシレン）である。ルイス酸を用いて縮合する場合、好適にはハロゲン化炭化水素類（特に好適にはジクロロメタン）である。

また、上記反応において、化合物（IV）が酸付加塩である場合、塩基を用いて反応させることができる。そのような塩基は、例えば、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのような有機アミン類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；であり、好適には有機アミン類（特に好適にはトリエチルアミン）である。

反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常-20℃乃至200℃であり、ルイス酸を用いて縮合する場合、好適には10℃乃至40℃であり、有機スルホン酸を触媒として加熱縮合する場合、好適には50℃乃至150℃である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至48時間であり、好適には、1時間乃至30時間である。

反応終了後、本反応の目的化合物（V）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、クロマトグラフィーを応用し、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

第A2工程は、化合物（II）を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（V）を還元した後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定はされず、例えば、前記第A1工程で使用されるものと同様であり、好適にはアルコール類またはエーテル類（特に好適には、メタノールまたはテトラヒドロフラン）である。

上記反応に使用される還元剤は、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような水素化ホウ素アルカリ金属類；水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリエトキシアルミニウムリチウムのような水素化アルミニウム化合物；であり、好適には水素化ホウ素アルカリ金属類（特に好適には水素化シアノホウ素ナトリウム）である。

反応温度は、原料化合物、使用される還元剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 -20°C 乃至 150°C であり、好適には 10°C 乃至 80°C である。

反応時間は、原料化合物、使用される還元剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至24時間であり、好適には、30分乃至16時間である。

アミノ基の保護基は、上記の反応後、有機合成化学の分野で通常使用される方

法により除去される。

保護基が、*t*-ブトキシカルボニル基、メトキシベンジル基またはメトキシベンジルオキシカルボニル基である場合は、相当する化合物を不活性溶剤（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類、好適には、エーテル類）中、酸（例えば、塩酸、硫酸、硝酸のような鉱酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、*p*-トルエンスルホン酸のような有機酸等、好適には、塩酸）と、0℃乃至50℃（好適には、室温付近）で、30分乃至5時間（好適には、1時間乃至2時間）反応することにより、保護基が除去される。

また、保護基がハロゲノアセチル基である場合は、相当する化合物を不活性溶剤（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類等、好適には、アミド類）中、チオウレアと、0℃乃至50℃（好適には、室温付近）で、30分乃至5時間（好適には、1時間乃至2時間）反応することにより、保護基が除去される。

さらにまた、保護基が、置換されていてもよいベンジル基または置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基である場合は、相当する化合物を不活性溶剤（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、好適には、アルコール類）中、接触還元触媒（例えば、パラジウム-炭素、酸化白金等）の存在下、水素（好適には、1乃至3気圧）と、0℃乃至50℃（好適には、室温付近）で、30分乃至10時間（好適には、1時間乃至5時間）反応することにより、保護基が除去される。

反応終了後、本反応の目的化合物（I I）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的

化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、クロマトグラフィーを応用し、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

B法は、化合物(I I)において、 R^1 がテトラゾリル基である化合物(I I d)および R^1 がテトラゾリル基で置換された C_{10} -アリール基である化合物(I I e)を製造する方法である。

第B1工程は、一般式(I I d)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式(V I)を有する化合物とアジド化合物を反応させた後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定されず、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類；ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；であり得、好適には炭化水素類（特に好適にはトルエン）である。

上記反応に使用されるアジド化合物は、例えば、リチウムアジド、ナトリウムアジド、カリウムアジドのようなアルカリ金属アジド類；マグネシウムアジド、カルシウムアジドのようなアルカリ土類金属アジド類；トリメチルシリルアジドのようなトリ C_{10} -アルキルシリルアジド類；トリメチル錫アジドのようなトリ C_{10} -アルキル錫アジド類；であり、好適にはアルカリ金属アジド類（特に好適にはナトリウムアジド）である。

また上記反応に於て、アジド化合物は単独で用いる他、例えば、塩化アルミニ

ウム、塩化第2錫、トリ-*n*-ブチル錫クロライド、塩化亜鉛、塩化チタン、トリフルオロボラン-ジエチルエーテル複合体のようなルイス酸、塩化アンモニウム、塩化テトラメチルアンモニウムのようなアンモニウム塩類、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸のようなスルホン酸類、塩化リチウムなどのアルカリ金属塩化物類、トリエチルアミン塩酸塩のようなアミン塩類と併用してもよく、好適にはルイス酸（特に好適にはトリ-*n*-ブチル錫クロライド）である。

反応温度は、原料化合物、使用されるアジド化合物、溶媒の種類等により異なるが、通常20℃乃至200℃（好適には、50℃乃至150℃）である。

反応時間は、原料化合物、使用されるアジド化合物、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至24時間（好適には、30分乃至16時間）である。

アミノ基の保護基の除去は、上記の反応後、前記A法第A2工程の後段と同様に行われる。

反応終了後、本反応の目的化合物（IId）は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、クロマトグラフィーを応用し、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

第B2工程は、一般式（IIe）を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式（VII）を有する化合物とアジド化合物を反応させた後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われ、本工程は前記B法第B1工程と同様に行われる。

C法は、化合物（II）において、R¹が、C₁-C₁₀アルキルスルホニル基または置換基群βから選択される基で1乃至3個置換されてもよいC₁-C₁₀ア

リールスルホニル基である化合物 (I I f)、 R^1 が $C_1 - C_{10}$ アルキルスルホニルで置換された $C_6 - C_{10}$ アリール基である化合物 (I I g) および R^1 が $C_1 - C_{10}$ アルキルスルフィニル基である化合物 (I I h) を製造する方法である。

第 C 1 工程は、一般式 (I I f) を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式 (V I I I) を有する化合物と酸化剤を反応させた後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われる。

上記反応に使用される溶媒は、反応に関与しなければ特に限定はされず、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、イソアミルアルコールのようなアルコール類；エーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；トリフルオロ酢酸のようなハロゲン化脂肪酸類；*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルホスホトリアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；硫酸水のような希釈酸；水酸化ナトリウム水のような希釈塩基；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；ピリジンのような有機塩基；アセトニトリルのようなニトリル類；水；であり、好適にはハロゲン化脂肪酸類（特に好適にはトリフルオロ酢酸）である。

上記反応に使用される酸化剤は、通常の酸化反応に使用されるものであれば特に限定はされず、例えば、過マンガン酸カリウム、二酸化マンガンのような酸化マンガン類；四酸化ルテニウムのような酸化ルテニウム類；二酸化ゼレンのようなゼレン化合物；塩化鉄のような鉄化合物；四酸化オスミウムのようなオスミウム化合物；酸化銀のような銀化合物；酢酸水銀のような水銀化合物；酸化鉛、四酢酸鉛のような酸化鉛化合物；クロム酸カリウム、クロム酸-硫酸錯体、クロム

酸-ピリジン錯体のようなクロム酸化合物；アンモニウムセリウムナイトレイト (CAN) のようなセリウム化合物等の無機金属酸化剤；塩素分子、臭素分子、沃素分子のようなハロゲン分子；過沃素酸ナトリウムのような過沃素酸類；オゾンのような酸化性気体；過酸化水素水、亜硝酸のような亜硝酸化合物；亜塩素酸カリウム、亜塩素酸ナトリウムのような亜塩素酸化合物；過硫酸カリウム、過硫酸ナトリウムのような過硫酸化合物等の無機酸化剤；*t*-ブチルヒドロパーオキシドのようなパーオキシド類；過酸化水素、*m*-クロロ過安息香酸 (mCPBA)、過酢酸のような有機過酸類；トリフェニルメチルカチオンのような安定なカチオン類；次亜塩素酸*t*-ブチルのような次亜塩素酸化合物；亜硝酸メチルのような亜硝酸エステル類；2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-*p*-ベンゾキノン (DDQ) のようなキノン化合物等の有機酸化剤；であり、好適には、パーオキシド類または有機過酸類（特に好適には過酸化水素水または*m*-クロロ過安息香酸）である。

反応温度は、原料化合物、使用される酸化剤、溶媒の種類等により異なるが、通常-20℃乃至100℃（好適には、-10℃乃至50℃）である。

反応時間は、原料化合物、使用される酸化剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至24時間（好適には、30分乃至16時間）である。

アミノ基の保護基の除去は、上記の反応後、A法第A2工程の後段と同様に行われる。

反応終了後、本反応の目的化合物 (IIf) は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、クロマトグラフィーを応用し、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

第C2工程は、一般式(I Ig)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式(I X)を有する化合物と酸化剤を反応させた後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われ、本工程は、前記C法第C1工程と同様に行われる。

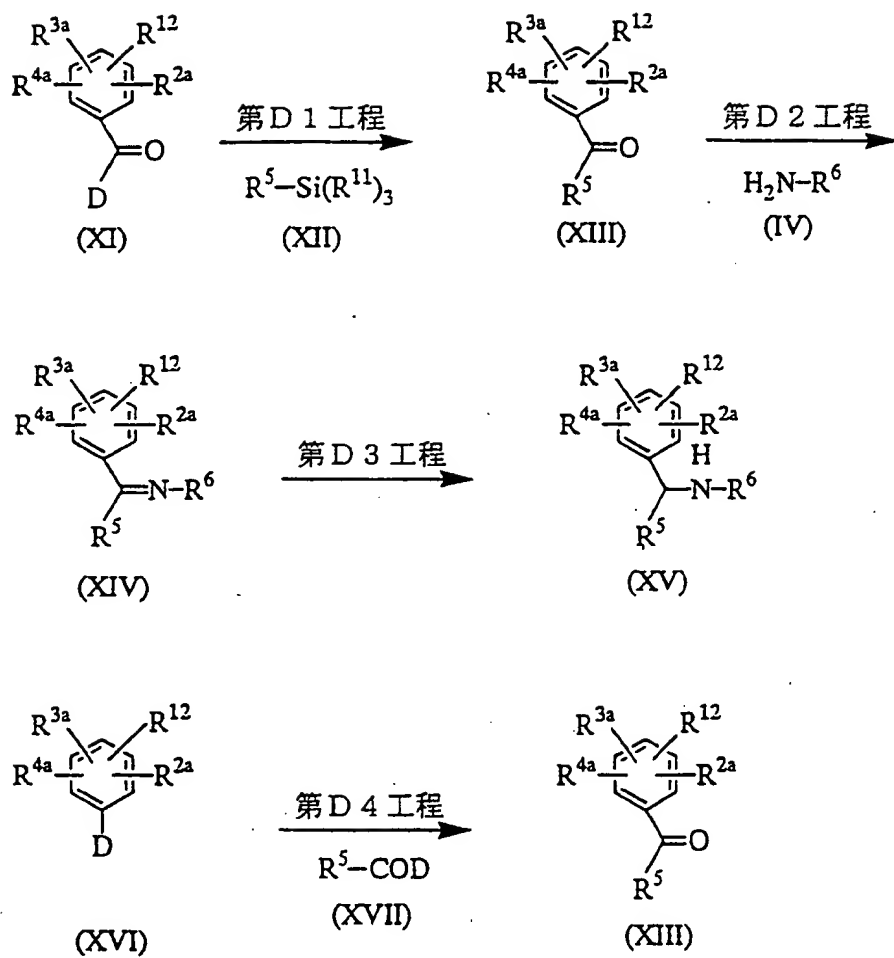
第C3工程は、一般式(I Ih)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式(X)を有する化合物と酸化剤を反応させた後、得られた化合物のアミノ基の保護基を除去することにより行われ、本工程は、前記C法第C1工程と同様に行われる。

反応温度は、原料化合物、使用される酸化剤、溶媒の種類等により異なるが、通常-50℃乃至100℃(好適には、-20℃乃至10℃)であり、反応時間は、原料化合物、使用される酸化剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至12時間(好適には、15分乃至5時間)である。

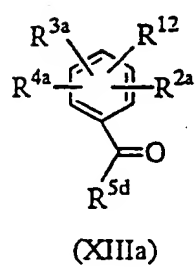
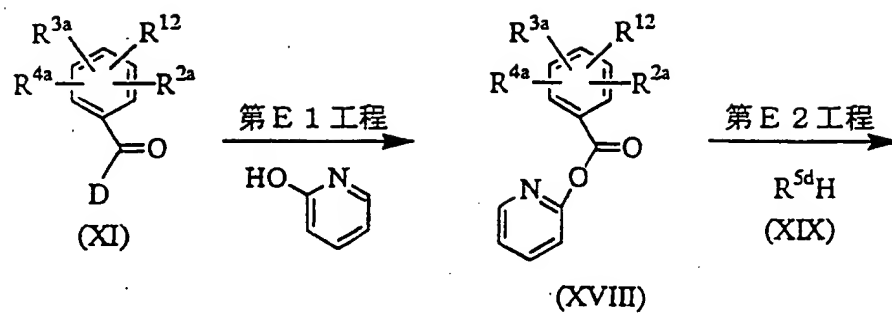
原料化合物(I I I)、(I V)、(V I)、(V I I)、(V I I I)、(I X)および(X)は、公知か、公知の方法またはそれに類似した方法に従って容易に製造される。[例えば、Can. J. Chem., 66, 1405 (1988)、J. Chem. Soc., 352 (1949)、Chem. Abstr., 62, 11709 (1965)、J. Am. Chem. Soc., 98, 2928 (1976)、J. Org. Chem., 47, 34 (1982)等]。

また、原料化合物(I I I)、(V I)、(V I I)、(V I I I)、(I X)および(X)は、以下の方法によっても製造される。

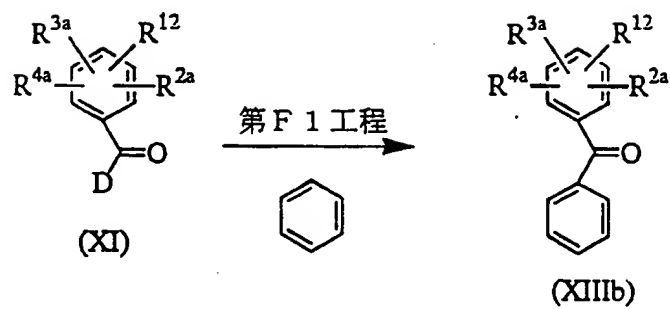
D 法



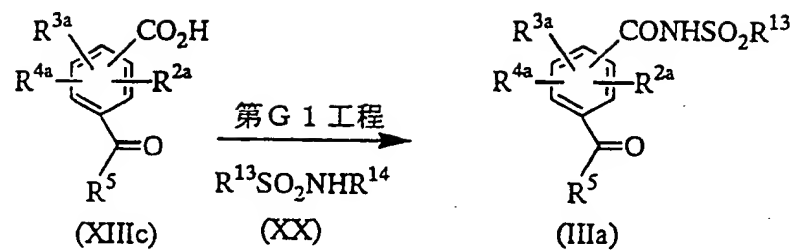
E 法



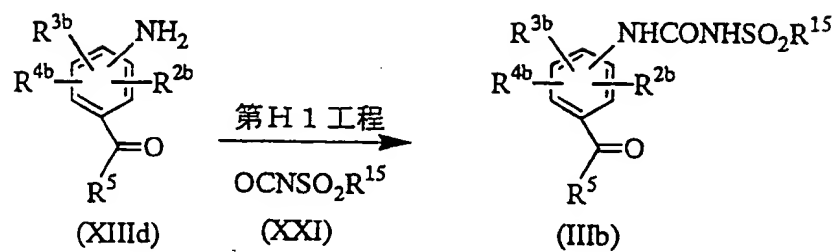
F 法



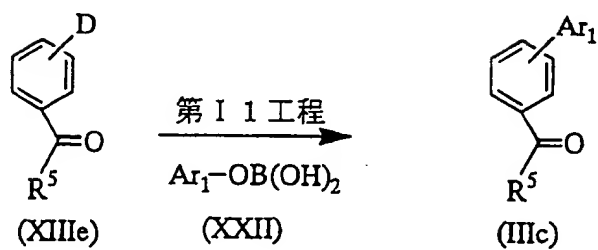
G 法



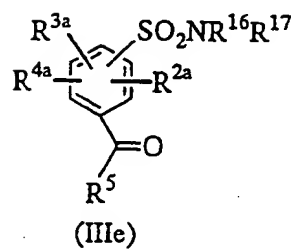
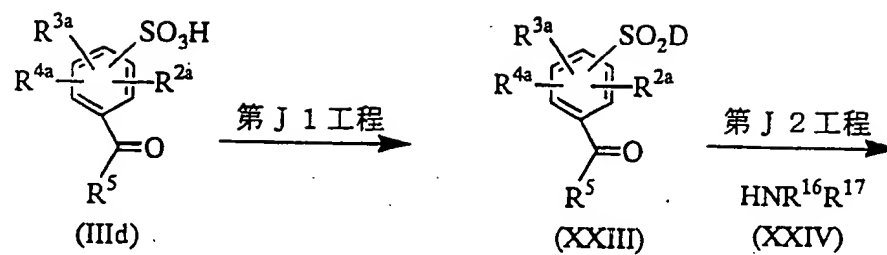
H 法



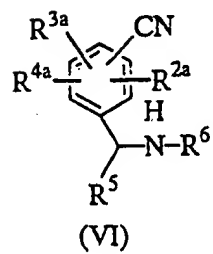
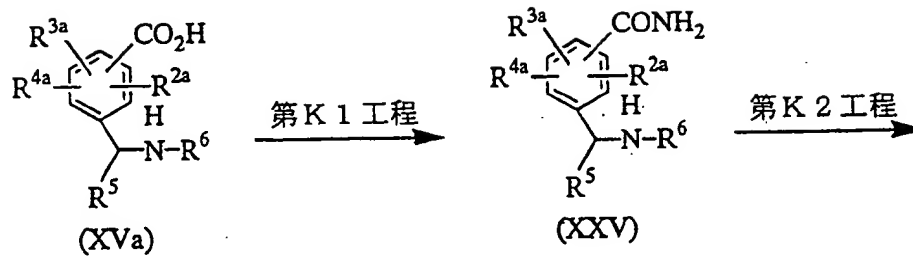
I 法



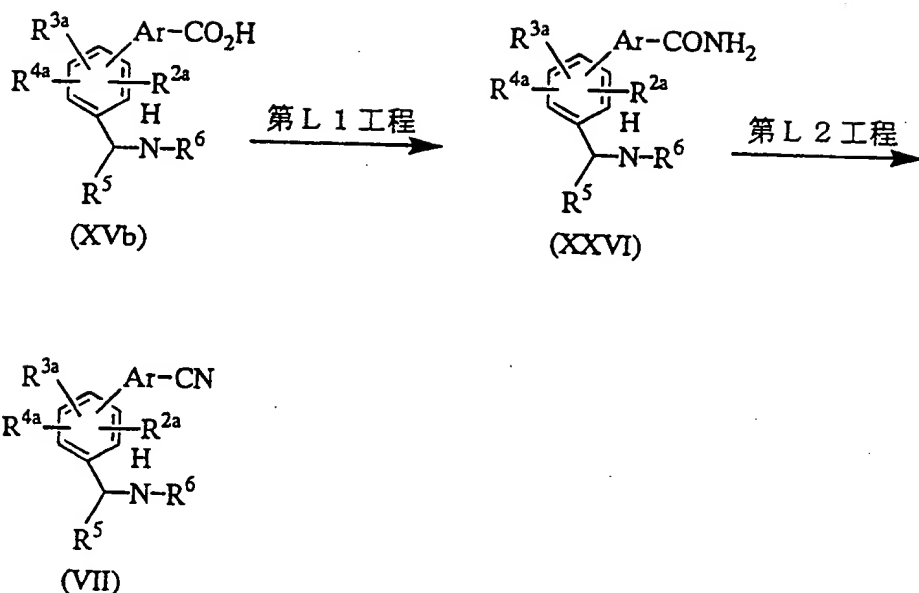
J 法



K 法



L 法



上記式中、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{4a} 、 R^5 、 R^6 および Ar は前述したものと同意義を示し、 R^{2b} 、 R^{3b} および R^{4b} は、それぞれの基に含まれるアミノ基が保護されたアミノ基である他それぞれ R^2 、 R^3 および R^4 と同意義を示し、 R^{5d} は、2-チエニル、2-ピロリル、2-チアゾリル、2-オキサゾリル、2-ベンゾチエニル、2-インドリル、2-ベンゾチアゾリルまたは2-ベンゾオキサゾリル基を示し、 R^{11} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基を示し、 R^{12} は、カルボキシ基、シアノ基、アミノ基、式 $-SR^9$ を有する基、式 $-SR^{10}$ を有する基またはカルボキシ、シアノ若しくは式 $-SR^{10}$ を有する基で置換された $C_1 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^{13} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基または置換基群 δ から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^{14} は、リチウム、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示し、 R^{15} は、置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_1 - C_{10}$ アリール基を示し、 R^{16} は、 $C_1 -$

C。アルキル基を示し、R¹⁷は、水素原子またはC₁ - C₁₀アルキル基を示し、Dはハロゲン原子を示し、Ar¹は、置換基群αから選択される基で1乃至3個置換されたC₆ - C₁₀アリール基を示す。

D法は、化合物(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)および(X)を含む化合物(XV)を製造する方法である。

第D1工程は、化合物(XIII)を製造する工程で、一般式(XI)を有する化合物を、不活性溶媒中(好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類)、一般式(XII)を有する化合物と-20℃乃至200℃(好適には、0℃乃至150℃)で15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。

第D2工程は、一般式(XIV)を有する化合物を製造する工程で、化合物(XIII)を、不活性溶媒中、化合物(IV)またはその酸付加塩(例えば、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩のような鉱酸塩)と反応させることにより行われ、本工程は前記A法第A1工程と同様に行われる。

第D3工程は、一般式(XV)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(XIV)を還元することにより行われ、本工程は前記A法第A2工程と同様に行われる。

第D4工程は、化合物(XIII)を第D1工程とは別途製造する工程で、一般式(XVI)を有する化合物を、不活性溶媒中(好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類)、塩基(好適には、n-ブチルリチウム、t-ブチルリチウム、フェニルリチウムのような有機リチウム類)の存在下、一般式(XVII)を有する化合物と、-150℃乃至50℃(好適には、-100℃乃至0℃)で15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。尚、反応の経過とともに発生する酸を補足するために、有機アミン等(好適にはN, N, N', N'-テトラメチルエチレンジアミン)存在下、反応させることもできる。

E法は、化合物(X I I I)においてR⁵が、2-チエニル、2-ピロリル、2-チアゾリル、2-オキサゾリル、2-ベンゾチエニル、2-インドリル、2-ベンゾチアゾリルまたは2-ベンゾオキサゾリル基である化合物である化合物(X I I I a)を製造する方法である。

第E1工程は、一般式(X V I I I)を有する化合物を製造する工程で、化合物(X I)を、不活性溶剤中(好適には、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類またはトリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2、4、6-トリメチルピリジンのような有機アミン類)、塩基(好適には、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2、4、6-トリメチルピリジンのような有機アミン類)の存在下または非存在下、2-ヒドロキシピリジンと、-20℃乃至200℃(好適には、0℃乃至150℃)で、15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。

第E2工程は、化合物(X I I I a)を製造する工程で、化合物(X V I I I)を有する化合物を、トリフロロ酢酸中、一般式(X I X)を有する化合物と、-20℃乃至200℃(好適には、トリフロロ酢酸の沸点付近)で、15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。

F法は、化合物(X I I I)においてR⁵がフェニル基である化合物(X I I I b)を製造する方法である。

第F1工程は、化合物(X I I I b)を製造する工程で、一般式(X I)を有する化合物を、不活性溶剤中(好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類)、ベンゼンと、-20℃乃至200℃(好適には、0℃乃至150℃)で15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至20時間)反応させることにより行われる。

また、化合物(X I)を、不活性溶剤中(好適には、ジクロロメタン、1、2

ージクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン炭化水素類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類)、ベンゼンとルイス酸類(好適には、塩化アルミニウム、塩化亜鉛)を用いて縮合させることによっても行われ、20℃乃至200℃(好適には、50℃乃至150℃)で15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。

G法は、化合物(III)において、R¹が、(C₁ - C₆アルキル)スルホンカルバモイル基または置換基群δから選択される基で1乃至3個置換されてもよい(C₆ - C₁₀アリール)スルホンカルバモイル基である化合物(III a)を製造する方法である。

第G1工程は、一般式(III a)を有する化合物を製造する工程で、一般式(XIII c)を有する化合物またはその反応性誘導体を、不活性溶剤中(好適には、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類、ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類)、塩基(好適には、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,4,6-トリメチルピリジンのような有機アミン類)の存在下または非存在下、一般式(XX)を有する化合物と、-20℃乃至150℃(好適には、0℃乃至50℃)で15分間乃至24時間(好適には、30分間乃至16時間)反応させることにより行われる。

H法は、化合物(III)において、R¹が、置換基群βから選択される基で1乃至3個置換されてもよい(C₆ - C₁₀アリール)スルホンカルバモイルアミノ基である化合物(III b)を製造する方法である。

第H1工程は、化合物(III b)を製造する工程で、一般式(XIII d)を有する化合物を、不活性溶剤中(好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類)、一般式(XXI)を有する化合物と、0℃乃至150℃(好適には、0℃乃至50℃)で15分間乃至24時

間（好適には、30分間乃至16時間）反応させることにより行われる。

I法は、化合物（III）において、 R^1 が置換基群 α から選択される基で1乃至3個置換されたC₁₋₁₀アリール基であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素原子である化合物（IIIc）を製造する方法である。

第I1工程は、化合物（IIIc）を製造する工程で、一般式（XIIIe）を有する化合物を、不活性溶媒中（好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類、メタノール、エタノールのようなアルコール類、水または上記溶媒の混合溶媒）、水酸化パラジウムのような遷移金属触媒下、塩基（好適には、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類）の存在下または非存在下、窒素気圧下、一般式（XXII）を有する化合物と、-20℃乃至200℃（好適には、0℃乃至150℃）で15分間乃至48時間（好適には、30分間乃至24時間）反応させることにより行われる。

また、本反応は、テトラ-n-ブチルアンモニウムのような触媒を用いて行うことができる。

J法は、化合物（III）において、 R^1 が、モノ-（C₁-C₆アルキル）アミノスルホニル基またはジ-（C₁-C₆アルキル）アミノスルホニル基である化合物（IIIe）を製造する方法である。

第J1工程は、一般式（XXIII）を有する化合物を製造する工程で、一般式（III d）を有する化合物を、不活性溶剤中（好適には、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン炭化水素類）、塩化チオニル、塩化スルフリル、オキシ塩化リン、五塩化リン、ホスゲン、クロルスルホン酸のようなハロゲン化剤と、-20℃乃至200℃（好適には0℃乃至150℃）で、15分間乃至24時間（好適には30分間乃至16時間）反応させることにより行われる。

第J2工程は、化合物（IIIe）を製造する工程で、化合物（XXIII）

を、不活性溶剤中（好適には、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類）、塩基（好適には、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2, 4, 6-トリメチルピリジンのような有機アミン類）の存在下または非存在下、一般式（XXI V）またはその酸付加塩（好適には、塩酸塩）と、-20℃乃至150℃（好適には、0℃乃至100℃）で15分間乃至24時間（好適には、30分間乃至16時間）反応させることにより行われる。

K法は、化合物（VI）をD法と別途に製造する方法である。

第K1工程は、一般式（XXV）を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式（XVa）を有する化合物若しくはその酸付加塩（例えば、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩のような鉱酸塩）またはその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物、活性エステル類）とアンモニア水を反応させることによって行われ、例えば、酸ハライド法、混合酸無水物法、活性エステル法または縮合法によって行われる。

酸ハライド法は、化合物（XVa）をハロゲン化剤（例えば、チオニルクロリド、シュウ酸クロリド、五塩化リン等）と反応させ酸ハライド類を製造し、その酸ハライド類とアンモニア水を不活性溶媒中、塩基の存在下または非存在下（好適には、存在下）、反応させることにより達成される。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応に関与しないものであれば特に限定はされず、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類；ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン

、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；であり、好適には、エーテル類、ニトリル類、アミド類またはスルホキシド類（特に好適にはN，N-ジメチルホルムアミド）である。

上記反応に使用される塩基は、例えば、トリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのような有機アミン類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；であり、好適には有機アミン類（特に好適にはトリエチルアミン）である。

反応温度は、原料化合物、試薬、溶媒の種類等により異なるが、ハロゲン化剤と化合物（X V a）またはその酸付加塩との反応および酸ハライド類とアンモニア水との反応共、通常-20℃乃至150℃であり、好適には、ハロゲン化剤と化合物（X V a）またはその酸付加塩との反応は-10℃乃至50℃であり、酸ハライド類とアンモニア水との反応は0℃乃至100℃である。

反応時間は、原料化合物、試薬、溶媒、反応温度等により異なるが、両反応とも、通常15分乃至24時間であり、好適には、30分乃至16時間である。

混合酸無水物法は、ハロゲノ炭酸C₁-C₆アルキル、ジ-C₁-C₆アルキルシアノリン酸またはジ-C₁-C₆アリールホスホリルアジドと化合物（X V a）を反応させ、混合酸無水物類を製造し、その混合酸無水物類をアンモニア水と反応させることにより行われる。

混合酸無水物類を製造する反応は、クロル炭酸エチル、クロル炭酸イソブチルのようなハロゲノ炭酸C₁-C₆アルキル；ジメチルシアノリン酸、ジエチルシアノリン酸のようなジ-C₁-C₆アルキルシアノリン酸；またはジフェニルホスホリルアジド、ジ（p-ニトロフェニル）ホスホリルアジド、ジナフチルホスホリルアジドのようなジ-C₁-C₆アリールホスホリルアジドと化合物（X V a）を反応させることにより行われ、好適には、不活性溶媒中、塩基の存在下に行われる。

上記反応において使用される塩基および不活性溶媒は、上記の酸ハライド法で使用されるものと同様である。

反応温度は、原料化合物、試薬、溶媒の種類等により異なるが、通常 -20°C 乃至 50°C であり、好適には、 0°C 乃至 30°C である。

反応時間は、原料化合物、試薬、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至24時間であり、好適には、30分乃至16時間である。

混合酸無水物類とアンモニア水との反応は、不活性溶媒中で、塩基の存在下または非存在下（好適には存在下）で行われ、使用される塩基および不活性溶媒は、上記の酸ハライド法で使用されるものと同様である。

反応温度は、原料化合物、使用される塩基、溶媒の種類等により異なるが、通常 -20°C 乃至 100°C であり、好適には、 -10°C 乃至 50°C である。

反応時間は、原料化合物、使用される塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至24時間であり、好適には、30分乃至16時間である。

また、本方法において、ジ-C、 $-C$ 。アルキルシアノリン酸またはジ-C、 $-$ 。アリールホスホリルアジドを使用する場合には、塩基の存在下、化合物(X V a)とアンモニア水を直接反応させることもできる。

活性エステル法は、縮合剤（例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等）の存在下、化合物(X V a)を活性エステル化剤（例えば、N-ヒドロキシサクシンイミド、N-ヒドロキシベンゾトリアゾールのようなN-ヒドロキシ化合物等）と反応させ、活性エステル類を製造し、その活性エステル類をアンモニア水と反応させることにより達成される。

活性エステル類を製造する反応は、好適には、不活性溶媒中で行われ、使用される不活性溶媒は、上記の酸ハライド法で使用されるものと同様である。

反応温度は、原料化合物、試薬、溶媒の種類等により異なるが、活性エステル化反応では、通常 -20°C 乃至 50°C であり、好適には、 -10°C 乃至 30°C であり、活性エステル化合物とアンモニア水との反応では、通常 -20°C 乃至 50°C

℃であり、好適には、 -10°C 乃至 30°C である。

反応時間は、原料化合物、試薬、溶媒、反応温度等により異なるが、両反応とも、通常15分乃至24時間（好適には、30分乃至16時間）である。

縮合法は、縮合剤（例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、1-（N、N-ジメチルアミノプロピル）-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等）の存在下、化合物（X V a）とアンモニア水を直接反応させることにより行われる。本反応は、前記の活性エステル類を製造する反応と同様に行われる。

第K2工程は、化合物（V I）を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物（X X V）と脱水化剤を反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応に関与しなければ特に限定はされず、例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンのような炭化水素類；ジクロルメタン、1, 2-ジクロルエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；アセトニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類（特に好適にはジクロルメタン）である。

上記反応に使用される脱水化剤は、例えば、五塩化リン、オキシ塩化リン、オキシ臭化リンのようなハロゲン化リン化合物；塩化チオニル、臭化チオニルのようなハロゲン化チオニル化合物；無水トリフルオロ酢酸、塩化メタンスルホニル、塩化パラトルエンスルホニル、トリフロロメタンスルホン酸無水物；であり、好適にはハロゲン化リン化合物（特に好適にはオキシ塩化リン）である。

反応温度は、原料化合物、使用される脱水化剤、溶媒の種類等により異なるが、通常 -20°C 乃至 100°C （好適には、 -10°C 乃至 50°C ）である。

反応時間は、原料化合物、使用される脱水化剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常15分乃至24時間（好適には、30分乃至16時間）である。

L法は、化合物(VII)をD法と別途に製造する方法である。

第L1工程は、一般式(XXVI)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、一般式(XVb)を有する化合物若しくはその酸付加塩（例えば、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩のような鉱酸塩）またはその反応性誘導体（酸ハライド類、混合酸無水物、活性エステル類）とアンモニア水を反応させることによって行われ、本工程は前記K法第K1工程と同様に行われる。

第L2工程は、化合物(VII)を有する化合物を製造する工程で、不活性溶媒中、化合物(XXVI)と脱水化剤を反応させることにより行われ、本工程は前記K法第K2工程と同様に行われる。

反応終了後、各反応の目的化合物は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、クロマトグラフィーを応用し、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

原料化合物(XI)、(XII)、(XVI)、(XVII)、(XIX)、(XX)、(XXI)、(XXII)および(XXIV)は、公知であるか、公知の方法によって容易に製造される。[例えば、Acta. Chim. Acad. Hung., 34, 75-76 (1962)、Chem. Ber., 28, 1625 (1895)、Chem. Abstr., 71, 123951j (1969)等]。

(発明の効果)

本発明の化合物(I)若しくは(II)またはその薬理上許容される塩は、優

れた回腸型胆汁酸トランスポーター阻害作用を有し、高脂血症、動脈硬化症の治療剤または予防剤として有用である。

〔産業上の利用可能性〕

本発明の化合物（I）若しくは（II）またはその薬理上許容される塩を回腸型胆汁酸トランスポーター阻害剤または高脂血症、動脈硬化症の治療剤若しくは予防剤として使用する場合には、それ自体あるいは適宜の薬理学的に許容される賦形剤、希釈剤と混合し、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくはシロップ剤等による経口的または注射剤等により非経口的に投与することができる。

これらの製剤は、賦形剤（例えば、乳糖、白糖、葡萄糖、マンニトール、ソルビトールのような糖誘導体；トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、 α 澱粉、デキストリンのような澱粉誘導体；結晶セルロースのようなセルロース誘導体；アラビアゴム；デキストラン；プルランのような有機系賦形剤；及び、軽質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、珪酸カルシウム、メタ珪酸アルミン酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体；リン酸水素カルシウムのようなリン酸塩；炭酸カルシウムのような炭酸塩；硫酸カルシウムのような硫酸塩等の無機系賦形剤を挙げることができる。）、滑沢剤（例えば、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩；タルク；コロイドシリカ；ビーガム、ゲイ蠟のようなワックス類；硼酸；アジピン酸；硫酸ナトリウムのような硫酸塩；グリコール；フマル酸；安息香酸ナトリウム；DLロイシン；脂肪酸ナトリウム塩；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩；無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類；及び、上記澱粉誘導体を挙げることができる。）、結合剤（例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、マクロゴール、及び、前記賦形剤と同様の化合物を挙げることができる。）、崩壊剤（例えば、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カ

ルボキシメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体；カルボキシメチルスターチ、カルボキシメチルスターチナトリウム、架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾されたデンプン・セルロース類を挙げることができる。）、安定剤（メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類；クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類；塩化ベンザルコニウム；フェノール、クレゾールのようなフェノール類；チメロサール；デヒドロ酢酸；及び、ソルビン酸を挙げることができる。）、矯味矯臭剤（例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、香料等を挙げることができる。）、希釈剤等の添加剤を用いて周知の方法で製造される。

その使用量は症状、年齢等により異なるが、経口投与の場合には、1回当たり1日下限1mg（好適には、10mg）、上限2000mg（好適には、400mg）を、静脈内投与の場合には、1回当たり1日下限0.1mg（好適には、1mg）、上限500mg（好適には、300mg）を成人に対して、1日当たり1乃至6回症状に応じて投与することが望ましい。

〔発明を実施するための最良の形態〕

以下に実施例、参考例、試験例および製剤例を示し、本発明を更に詳細に説明するが、本発明の範囲はこれらを限定するものではない。

実施例1

N-（1-エチルペンチル）-〔フェニル-〔3-（1H-テトラゾール-5-イル）フェニル〕メチル〕アミンシュウ酸塩（例示化合物番号1-447）

143mgのN-（1-エチルペンチル）-〔フェニル-（3-シアノフェニル）メチル〕アミンを4.2mlの無水トルエンに溶解させ、43mgのナトリウムアジドと0.19mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを加え、室温で30分攪拌した後、2時間加熱還流した。反応液に43mgのナトリウムアジドと0

1.9 ml のトリ-*n*-ブチル錫クロライドを加え、2 時間加熱還流した後、43 mg のナトリウムアジドと 0.19 ml のトリ-*n*-ブチル錫クロライドを加え、1 時間還流した。反応液に 1.98 ml の 1 規定塩酸水を加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で分離精製し、フリー体を無色結晶として 54 mg 得た後、フリー体 54 mg を用いて、標記目的化合物をシュウ酸塩として 44 mg 得た。

融点：209－211℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.75-0.90 (6H, m), 1.10-1.35 (4H, m), 1.50-1.80 (4H, m), 2.60-2.75 (1H, m), 5.60 (1H, s), 7.30-8.00 (8H, m), 8.36 (1H, s)。

実施例 2

N-（1-エチルペンチル）-〔フェニル-（2-メチルスルホニルフェニル）メチル〕アミン塩酸塩（例示化合物番号 1-884）

（2a）N-（1-エチルペンチル）-〔フェニル-（2-メチルチオフェニル）メチル〕アミン

1.96 g の 2-メチルチオベンゾフェノンと 1.96 g の 1-エチルペンチルアミン塩酸塩を 46 ml の無水ジクロルメタンに溶解させ、窒素気流下、氷冷撹拌下、6.75 ml のトリエチルアミンと 9.70 ml の四塩化チタン-ジクロルメタンの 1 モル溶液を加え、反応液を室温で 17 時間撹拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、0.5 規定塩酸水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査を 56 ml のメタノールに溶解させ、0.74 ml の酢酸と 2.162 g のナトリウムシアノボロヒドリドを加え、1 時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧

下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝9／1）で分離精製し、目的物を無色油状物として2.584 g得た。

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 0.80-0.95 (6H, m), 1.20-1.60 (9H, m), 2.35-2.45 (1H, m), 2.41 (3H, s), 5.46 (1H, s), 7.10-7.70 (9H, m)。

(2b) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-メチルスルホニルフェニル)メチル]アミン塩酸塩

氷塩冷却下、1.2 ml トリフルオロ酢酸に0.59 ml の30%過酸化水素水を滴下した後、実施例(2a)の化合物N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-メチルチオフェニル)メチル]アミン618 mgを1.4 ml のトリフルオロ酢酸に溶解させ、滴下し、室温で一夜攪拌した。反応液に重曹水を加え中和させ、酢酸エチルで抽出した後、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝8／1）で分離精製し、標記化合物を無色油状物として383 mg得た後、この無色油状物を塩酸塩として338 mg得た。

融点：180-182℃

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 0.75-0.95 (6H, m), 1.10-1.80 (8H, m), 2.68 (1.5H, s), 2.70-2.90 (1H, m), 3.08 (1.5H, s), 6.96 (1H, br. s), 7.25-8.15 (8H, m), 8.65 (0.5H, d, J=7.9Hz), 8.73 (0.5H, d, J=8.0Hz), 9.70-10.25 (2H, br. s)。

実施例 3

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩（例示化合物番号1-1414）

(3a) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン

1.50 g の2-n-ブチルチオベンゾフェノンと1.68 g の1-エチルペ

ンチルアミン塩酸塩を用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡褐色油状物として1.45g得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.80-0.95(9H, m), 1.15-1.70(12H, m), 2.35-2.50(1H, m), 2.75-2.90(2H, m), 5.58(1H, s), 7.10-7.70(9H, m)。

(3b) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-n-ブチルスルホンニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

実施例(3a)のN-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン1.25g、4.3mlのトリフルオロ酢酸および0.96mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として1.33g得た後、この淡黄色油状物0.50gからシュウ酸塩として353mg得た。

融点: 143-145℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.70-1.05(9H, m), 1.00-1.95(12H, m), 2.70-3.10(3H, m), 6.71(0.7H, s), 6.74(0.3H, s), 7.30-8.10(9H, m)。

実施例4

N-シクロヘキシル-[フェニル-(2-メチルスルホンニルフェニル)メチル]アミン(例示化合物番号1-906)

(4a) N-シクロヘキシル-[フェニル-(2-メチルチオフェニル)メチル]アミン

2.0gの2-メチルチオベンゾフェノンと3.02mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色油状物として228mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.30(5H, m), 1.40-2.05(6H, m), 2.30-2.45(1H, m), 2.42(3H, s), 5.51(1H, s), 7.10-7.60(9H, m)。

(4b) N-シクロヘキシル-[フェニル-(2-メチルスルホンニルフェニル)メチル]アミン

実施例 (4 a) の N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-メチルチオフェニル) メチル] アミン 2.28 g、2.38 ml のトリフルオロ酢酸および 0.46 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2 b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 6.5 g 得た。

融点: 105-107℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.95-1.30 (5H, m), 1.45-2.10 (6H, m), 2.38-2.53 (1H, m), 2.78 (3H, s), 6.32 (1H, s), 7.20-8.10 (9H, m)。

実施例 5

N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-1436)

(5 a) N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルチオフェニル) メチル] アミン

2.0 g の 2-n-ブチルチオベンゾフェノンと 1.7 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡褐色油状物として 2.49 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.90 (3H, t, J=7.3Hz), 1.00-1.28 (5H, m), 1.30-1.75 (8H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.30-2.48 (1H, m), 2.75-2.90 (2H, m), 5.63 (1H, s), 7.10-7.60 (9H, m)。

(5 b) シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩

実施例 (5 a) の N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルチオフェニル) メチル] アミン 1.49 g、5.8 ml のトリフルオロ酢酸および 1.3 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2 b) と同様に反応させ、精製して、更に塩酸塩とし、標記化合物を無色結晶として 1.59 g 得た。

融点: 266-269℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.73 (3H, t, J=7.3Hz), 0.80-1.75 (12H, m),

1. 85-1. 98 (1H, m), 2. 15-2. 28 (1H, m), 2. 55-2. 80 (3H, m), 6. 99 (1H, s), 7. 25-7. 80 (7H, m), 8. 05 (1H, d, J=8. 0Hz), 8. 70 (1H, d, J=7. 9Hz)。

実施例 6

N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルフィニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1645)

実施例 (5a) の N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルチオフェニル) メチル] アミン 283 mg を 3. 0 ml のトリフルオロ酢酸に溶解させ、氷冷下、0. 08 ml の 30% 過酸化水素水を加え 30 分撹拌した後、反応液を重曹で中和し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤: シクロヘキサン/酢酸エチル=9/1) で分離精製し、212 mg の油状物を得た。この無色油状物をシュウ酸塩として、標記化合物を無色結晶として 188 mg 得た。

融点: 166-168℃ (分解)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0. 77 (3H, t, J=7. 3Hz), 0. 90-2. 00 (14H, m), 2. 25-2. 40 (2H, m), 2. 75-2. 95 (2H, m), 5. 99 (1H, s), 7. 20-8. 30 (9H, m)。

実施例 7

N-シクロヘキシル- [フェニル- (4-メチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1077)

(7a) N-シクロヘキシル- [フェニル- (4-メチルチオフェニル) メチル] アミン

1. 0 g の 4-メチルチオベンゾフェノンと 1. 01 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡桃色油状物として 812 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1. 00-1. 25 (5H, m), 1. 40-2. 00 (6H, m), 2. 30-2. 45 (1H, m), 2. 45 (3H, s), 4. 99 (1H, s), 7. 10-7. 40 (9H, m)。

(7b) N-シクロヘキシル-[フェニル-(4-メチルスルホニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

実施例(7a)のN-シクロヘキシル-[フェニル-(4-メチルチオフェニル)メチル]アミン517mgと5.1mlのトリフルオロ酢酸と1.1mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として426mg得た。

融点: 106℃(分解)

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.90-1.30(5H, m), 1.50-2.00(5H, m), 2.80-2.95(1H, m), 3.01(3H, s), 5.67(1H, s), 7.30-7.95(9H, m)。

実施例 8

N-イソプロピル-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-1409)

(8a) N-イソプロピル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン

1.0gの2-n-ブチルチオベンゾフェノンと0.63mlのイソプロピルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡褐色油状物として950mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.90(3H, t, J=7.3Hz), 1.09(6H, d, J=6.3Hz), 1.30-1.70(5H, m), 2.70-2.90(3H, m), 5.57(1H, s), 7.10-7.55(9H, m)。

(8b) N-イソプロピル-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

実施例(8a)のN-イソプロピル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン427mg、4.76mlのトリフルオロ酢酸および0.92mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、更にシュウ酸塩として、標記化合物を無色結晶として、159mg得た。

融点：158-160℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.73 (3H, t, J=7.3Hz), 1.00-1.70 (4H, m), 1.20 (3H, d, J=6.3Hz), 1.31 (3H, d, J=6.3Hz), 2.55-2.80 (2H, m), 3.20-3.45 (1H, m), 6.81 (1H, s), 7.30-8.40 (9H, m)。

実施例 9

N-tert-ブチル-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミン (例示化合物番号 1-1411)

(9a) N-tert-ブチル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン

1.0gの2-n-ブチルチオベンゾフェノンと0.77mlのtert-ブチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色油状物として326mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.89 (3H, t, J=7.3Hz), 1.07 (9H, s), 1.30-1.65 (5H, m), 2.70-2.90 (2H, m), 5.61 (1H, s), 7.10-7.40 (8H, m), 7.88 (1H, d, J=7.2Hz)。

(9b) N-tert-ブチル-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミン

実施例(9a)のN-tert-ブチル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン185mg、3.0mlのトリフルオロ酢酸および0.42mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色柱状晶として115mg得た。

融点：74-76℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.62 (3H, t, J=7.2Hz), 0.75-1.05 (2H, m), 1.08 (9H, s), 1.35-1.58 (3H, m), 2.20-2.50 (2H, m), 6.39 (1H, s), 7.12-7.30 (5H, m), 7.40-7.48 (1H, m), 7.67-7.75 (1H, m), 7.95 (1H, d, J=7.9Hz), 8.61 (1H, d, J=7.9Hz)。

実施例 10

N-ネオペンチル-〔フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル〕アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-1412)

(10a) N-ネオペンチル-〔フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル〕アミン

500mgの2-n-ブチルチオベンゾフェノンと0.44mlのネオペンチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡褐色油状物として520mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.80-1.00(12H, m), 1.35-1.70(5H, m), 2.34(2H, s), 2.75-2.95(2H, m), 5.33(1H, s), 7.10-7.55(9H, m)。

(10b) N-ネオペンチル-〔フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル〕アミンシュウ酸塩

実施例(10a)のN-ネオペンチル-〔フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル〕アミン520mg、2.0mlのトリフルオロ酢酸および0.4mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、無色油状物を533mg得、この油状物276mgから標記化合物を無色結晶として281mg得た。

融点: 155-157℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.91(3H, t, J=7.3Hz), 1.07(9H, s), 1.27-1.95(4H, m), 2.80(2H, dd, J=12.0Hz, J=7.3Hz), 2.95-3.30(2H, m), 6.18(1H, s), 7.40-7.75(8H, m), 8.00(1H, d, J=7.1Hz)。

実施例 11

N-シクロヘキシル-〔(1,1-ジオキシベンゾチオフェン-3-イル)-(2-メチルスルホニルフェニル)メチル〕アミン(例示化合物番号3-423)

(11a) N-シクロヘキシル-〔(ベンゾチオフェン-3-イル)-(2-

メチルチオフェニル) メチル] アミン

参考例 5 で得られた 397 mg の (ベンゾチオフェン-3-イル) - (2-メチルチオフェニル) ケトンと 0.96 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、標記化合物を黄色油状物として 346 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 1.00-1.80 (9H, m), 1.90-2.15 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.50-2.65 (1H, m), 5.88 (1H, s), 7.05-7.90 (9H, m)。

(11b) N-シクロヘキシル-[(1,1-ジオキシベンゾチオフェン-3-イル) - (2-メチルスルホニルフェニル) メチル] アミン

実施例 (11a) の N-シクロヘキシル-[(ベンゾチオフェン-3-イル) - (2-メチルチオフェニル) メチル] アミン 346 mg、5.0 ml のトリフルオロ酢酸および 0.5 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、標記化合物を無色結晶として 115 mg 得た。

融点: 147-150°C

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.95-1.25 (5H, m), 1.45-2.05 (5H, m), 2.40-2.55 (1H, m), 2.91 (1H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 3.35 (3H, s), 6.32 (1H, d, $J=11.1\text{Hz}$), 6.96 (1H, s), 7.55-7.90 (7H, m), 8.05 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$)。

実施例 12

(12-1) N-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルスルフィニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 3-144) および

(12-2) N-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 3-100)

(12a) N-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルチオフェニル) メチル] アミン

参考例 2 で得られた 455 mg の (2-チエニル) - 2-メチルチオフェニル ケトンと 0.89 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様

に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として435mg得た。

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 1.03-1.30(5H, m), 1.50-1.80(4H, m), 1.85-2.10(2H, m), 2.35-2.55(1H, m), 2.45(3H, s), 5.77(1H, s), 6.80-6.95(2H, m), 7.10-7.30(4H, m), 7.54(1H, d, J=6.8Hz)。

(12b-1) N-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルスルフィニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩および

(12b-2) N-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルスルホニルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

実施例(12a)のN-シクロヘキシル-[2-チエニル-(2-メチルチオフェニル)メチル]アミン435mgを3.0mlのトリフルオロ酢酸に溶解させ、氷塩冷却撹拌下、0.26mlの30%過酸化水素水を加え、氷塩冷却下、45分撹拌した。飽和重曹水で中和し、酢酸エチルで抽出した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ジクロルメタン/酢酸エチル=2/1)で分離精製し、最初の流出部分が52mg得られた。これをシュウ酸塩とすると(12b-2)の標記化合物が無色結晶として49.9mg得られた。次の流出部分を387mg得た。この387mgをシュウ酸塩として(12b-1)の標記化合物が無色結晶として411mg得られた。

(12b-1)

融点: 138-143℃

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 0.95-1.30(5H, m), 1.40-2.05(5H, m), 4.41(2H, s), 2.79(1H, s), 5.76(0.33H, s), 5.79(0.67H, s), 6.90-8.00(7H, m)。

(12b-2)

融点: 184℃(分解)

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.00-1.30(5H, m), 1.40-2.05(5H, m), 2.45-2.60(1H, m), 3.14(3H, s), 6.53(1H, s), 6.95-7.10(2H, m), 7.50(1H, d, J=4.

9Hz), 7.61 (1H, t, J=7.5Hz), 7.81 (1H, t, J=7.3Hz), 7.98 (1H, d, J=8.0Hz), 8.06 (1H, d, J=7.8Hz)。

実施例 13

N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン (例示化合物番号 1-1522)

(13a) N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-フェニルチオフェニル) メチル] アミン

500mgの2-フェニルチオベンゾフェノンと0.4mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として620mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.90-1.25 (5H, m), 1.40-2.00 (6H, m), 2.25-2.42 (1H, m), 5.67 (1H, s), 7.10-7.70 (14H, m)。

(13b) N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン

実施例(13a)のN-シクロヘキシル- [フェニル- (2-フェニルチオフェニル) メチル] アミン500mgと2.0mlのトリフルオロ酢酸と0.77mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として300mg得た。

融点: 96-98℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.80-1.20 (5H, m), 1.35-1.85 (6H, m), 2.10-2.28 (1H, m), 5.86 (1H, m), 6.98-7.20 (5H, m), 7.35-7.70 (5H, m), 7.75-7.90 (3H, m), 8.20 (1H, d, J=7.9Hz)。

実施例 14

N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン (例示化合物番号 1-1160)

(14a) N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メ

チル] アミン

参考例 6 で得られた 0.50 g の 2-エチルチオベンゾフェノンと 0.5 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄褐色油状物として 0.75 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.25 (5H, m), 1.28 (3H, t, J=7.4 Hz), 1.45-1.78 (4H, m), 1.88-2.18 (2H, m), 2.30-2.45 (1H, m), 2.80-2.95 (2H, m), 5.62 (1H, s), 7.12-7.55 (9H, m)。

(14 b) N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン

実施例 (14 a) の N-シクロヘキシル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メチル] アミン 0.50 g、2.0 ml のトリフルオロ酢酸および 0.87 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2 b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 0.38 g 得た。

融点: 93-94 °C

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.90-1.25 (8H, m), 1.40-2.08 (6H, m), 2.38-2.50 (1H, m), 2.73-2.95 (2H, m), 6.29 (1H, s), 7.20-7.50 (6H, m), 7.60-7.70 (1H, m), 7.93 (1H, d, J=6.9 Hz), 8.02 (1H, dd, J=1.2 Hz, J=7.9 Hz)。

実施例 15

N-ベンジル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-1178)

(15 a) N-ベンジル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メチル] アミン

参考例 6 で得られた 0.50 g の 2-エチルチオベンゾフェノンと 0.45 ml のベンジルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 0.66 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.26 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.84 (2H, q, J=7.3 Hz)

, 3.75 (2H, s), 5.48 (2H, s), 7.15-7.65 (14H, m)。

(15b) N-ベンジル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩

実施例 (15a) のN-ベンジル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メチル] アミン0.50g、2.0mlのトリフルオロ酢酸および0.83mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として0.48g得た。

融点: 247-248℃ (分解)

NMRスペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.09 (3H, t, J=7.3Hz), 2.50-2.85 (2H, m), 3.70-4.15 (2H, m), 6.39 (1H, d, H=6.1Hz), 7.25-7.70 (10H, m), 7.85-8.10 (3H, m), 8.51 (1H, d, J=7.8Hz), 10.60-11.20 (2H, br. s)。

実施例 16

N-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1175)

(16a) N-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メチル] アミン

参考例6で得られた1.50gの2-エチルチオベンゾフェノンと2.60gのトランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として2.32g得た。

NMRスペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.85-1.05 (2H, m), 1.29 (3H, t, J=7.5Hz), 1.30-1.65 (4H, m), 1.82-2.05 (4H, m), 2.15-2.30 (1H, m), 2.44 (2H, d, J=6.6Hz), 2.88 (2H, q, J=7.4Hz), 3.66 (3H, s), 5.34 (1H, s), 7.10-7.53 (9H, m) 。

(16b) N-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル- [フェニル- (2-エチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

実施例 (16a) のN-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル- [フェニル- (2-エチルチオフェニル) メチル] アミン 2.0 g, 8.0 ml のトリフルオロ酢酸および 2.9 ml の30%過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、無色油状物を 1.83 g 得、この油状物 0.2 g から、標記化合物を無色結晶として 0.15 g 得た。

融点: 132-134℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.80-1.05 (2H, m), 1.14 (3H, t, J=7.4Hz), 1.30-1.65 (4H, m), 2.15-2.30 (1H, m), 2.38 (1H, dd, J=6.8Hz, J=11.3Hz), 2.55 (1H, dd, J=6.2Hz, J=11.3Hz), 2.80-3.05 (2H, m), 3.65 (3H, s), 5.94 (1H, s), 7.20-7.50 (6H, m), 7.55-7.65 (1H, m), 7.77 (1H, d, J=6.9Hz), 8.02 (1H, dd, J=1.2Hz, J=7.9Hz)。

実施例 17

N-4-メチルシクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1442)

(17a) N-4-メチルシクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルチオフェニル) メチル] アミン

500 mg の 2-n-ブチルチオベンゾフェノンと 0.49 ml の 4-メチルシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、2種類の標記化合物を淡黄色油状物として中間体 (17a-1) 227 mg と中間体 (17a-2) 104 mg を得た。

(17a-1)

R_f = 0.7 (展開溶媒: シクロヘキサン/酢酸エチル = 9/1)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.80-1.00 (6H, m), 1.20-1.75 (14H, m), 2.60-2.70 (1H, m), 2.75-2.90 (2H, m), 5.54 (1H, s), 7.13-7.60 (9H, m)。

(17a-2)

R_f = 0.5 (展開溶媒: シクロヘキサン/酢酸エチル = 9/1)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.83 (3H, d, J=6.5Hz), 0.90 (3H, t, J=7.3Hz), 1.00-1.75 (12H, m), 1.93-2.10 (2H, m), 2.26-2.40 (1H, m), 2.78-2.90 (2H, m), 5.63 (1H, s), 7.10-7.60 (9H, m)。

(17b-1) N-4-メチルシクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

中間体 (17a-1) 211mg、3.0ml のトリフルオロ酢酸および 0.5ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、更にシュウ酸塩とし、標記化合物を無色結晶として 174mg 得た。

融点 : 202-204℃

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.71 (3H, t, J=7.3Hz), 0.89 (3H, d, J=6.7Hz), 1.05-1.80 (13H, m), 2.62-2.78 (1H, m), 2.90-3.15 (2H, m), 6.34 (1H, s), 7.25-8.10 (9H, m)。

(17b-2) N-4-メチルシクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミン

中間体 (17a-2) と (17a-1) の混合物 315mg、2.5ml のトリフルオロ酢酸および 0.5ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、R_f = 0.48 (展開溶媒 : シクロヘキサン / 酢酸エチル = 4 / 1) の部分だけを取り、標記化合物を無色結晶として 62mg 得た。

融点 : 89-91℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.75 (3H, t, J=7.3Hz), 0.83 (3H, d, J=6.5Hz), 1.00-1.75 (12H, m), 1.88-2.00 (1H, m), 2.00-2.12 (1H, m), 2.30-2.45 (1H, m), 2.65-2.90 (2H, m), 6.30 (1H, s), 7.20-8.05 (9H, m)。

実施例 18

N-4-tert-ブチルシクロヘキシル- [フェニル- (2-n-ブチルスルホニルフェニル) メチル] アミン (例示化合物番号 1-1443)

(18a) N-4-tert-ブチルシクロヘキシル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン

600mgの2-n-ブチルチオベンゾフェノンと0.79mlの4-tert-ブチルシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として362mg得た。

融点: 81-83℃

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 0.80(9H, s), 0.85-1.15(4H, m), 0.91(3H, t, J=7.3Hz), 1.30-1.80(8H, m), 2.00-2.15(2H, m), 2.22-2.40(1H, m), 2.75-2.90(2H, m), 5.63(1H, s), 7.10-7.55(9H, m)。

(18b) N-4-tert-ブチルシクロヘキシル-[フェニル-(2-n-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミン

実施例(18a)のN-4-tert-ブチルシクロヘキシル-[フェニル-(2-n-ブチルチオフェニル)メチル]アミン358mg、1.5mlのトリフルオロ酢酸および0.4mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として272mg得た。

融点: 120-122℃

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 0.75(3H, t, J=7.3Hz), 0.80(9H, s), 0.85-1.80(12H, m), 1.93-2.20(2H, m), 2.30-2.45(1H, m), 2.70-2.90(2H, m), 6.30(1H, s), 7.20-8.05(9H, m)。

実施例19

N-シクロヘキシル-[p-トリル-(2-シクロヘキシルカルバモイルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-630)

500mgの2-(4-メチルベンゾイル)安息香酸と0.71mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として78.5mg得た。

融点: 183-185℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.95-2.20 (20H, m), 2.27 (3H, s), 2.50-2.70 (1H, m), 6.01 (1H, s), 7.10-7.65 (7H, m), 7.79 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 8.52 (1H, d, $J=7.7$ Hz)。

実施例 20

N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [6 - フルオロ - 3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン及びその塩酸塩 (例示化合物番号 1 - 1876)

(20a) N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - [フェニル - (3 - シアノ - 6 - フルオロフェニル) メチル] アミン

参考例 28 で得られた 3 - ベンゾイル - 4 - フルオロベンゾニトリル 420 mg と 0.48 ml の (R) - 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を黄色油状物として 230 mg、異性体 B を黄色油状物として 203 mg 得た。

異性体 A

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.40 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.61 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.93 (1H, s), 7.06 (1H, dd, $J=8.7$ Hz, $J=9.7$ Hz), 7.19-7.39 (10H, m), 7.53-7.58 (1H, m), 8.09 (1H, dd, $J=2.1$ Hz, $J=6.7$ Hz)。

異性体 B

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.39 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.70 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.97 (1H, s), 6.98 (1H, dd, $J=8.6$ Hz, $J=9.7$ Hz), 7.19-7.39 (10H, m), 7.43-7.48 (1H, m), 7.89 (1H, dd, $J=2.1$ Hz, $J=6.7$ Hz)。

(20b) N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [6 - フルオロ - 3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン及びその塩酸塩

225 mg の実施例 (20a) の異性体 A、133 mg のナトリウムアジドおよび 158 ml のトリブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応さ

せ、精製して、標記化合物の異性体Aのフリー体を白色粉末として115mg得た。

異性体A

融点：122-125℃（分解）

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 1.55 (3H, d, J=6.6Hz), 3.99-4.06 (1H, m), 5.22 (1H, s), 7.09-7.41 (11H, m), 8.24-8.29 (1H, m), 8.79-8.81 (1H, m)。

200mgの実施例(20a)の異性体B、118mgのナトリウムアジドおよび0.52mlのトリブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Bのフリー体を白色粉末として210mg得た。このフリー体200mgを用いて標記化合物を塩酸塩とし、黄色粉末として98mg得た。

異性体B

融点：130-134℃

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 1.47 (3H, d, J=6.6Hz), 4.19-4.29 (1H, m), 5.36 (1H, s), 7.42-7.60 (11H, m), 8.05-8.09 (1H, m), 8.60-8.63 (1H, m), 10.1-11.0 (1H, br. s)。

実施例21

N-シクロヘキシル-〔フェニル-〔4-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル〕メチル〕アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-215)

(21a) N-シクロヘキシル-〔フェニル-〔4-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル〕メチル〕アミン

参考例8で得られた312mgの4-(4-メチルチオフェニル)ベンゾフェノンと0.23mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として309mg得た。

融点：80-82℃

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 1.00-1.30 (5H, m), 1.45-2.05 (6H, m), 2.35

-2.50 (1H, m), 2.51 (3H, s), 5.07 (1H, s), 7.15-7.55 (13H, m)。

(21b) N-シクロヘキシル-〔フェニル-〔4-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル〕メチル〕アミンシュウ酸塩

実施例(21a)のN-シクロヘキシル-〔フェニル-〔4-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル〕メチル〕アミン195mgと3.0mlのトリフルオロ酢酸と0.5mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として20mg得た。

融点: 211-213℃

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.00-1.80 (8H, m), 2.05-2.20 (2H, m), 2.55-2.70 (1H, m), 3.26 (3H, s), 5.67 (1H, br. s), 7.30-8.05 (13H, m)。

実施例 22

N-トランス-4-カルボキシシクロヘキシルメチル-〔フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル〕アミン塩酸塩(例示化合物番号1-1174)

実施例16で得られたN-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル-〔フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル〕アミン0.30gを6.0mlのメタノールに溶解させ、氷冷攪拌下、2.1mlの1規定水酸化ナトリウムを加え、室温で6.5時間攪拌後、一夜放置した。氷冷攪拌下、2.1mlの1規定塩酸を加え、減圧下、溶媒を留去し、得られた残査にベンゼンを加え、共沸乾固した。得られた残査を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査を酢酸エチルを溶出溶剤とするシリカゲルカラムクロマトグラフィーで分離精製し、標記化合物を無色結晶として75mg得た。

融点: 253-255℃(分解)

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 0.80-1.35 (4H, m), 1.07 (3H, t, $J=7.3$ Hz), 1.70-1.98 (4H, m), 2.05-2.20 (1H, m), 2.75 (2H, d, $J=3.3$ Hz), 3.21 (2H, q, $J=7.3$ Hz)

), 3.25-3.50 (1H, m), 6.46 (1H, br. s), 7.30-7.50 (3H, m), 7.65-7.80 (3H, m), 7.93 (1H, t, J=7.6Hz), 8.01 (1H, d, J=7.9Hz), 8.41 (1H, d, J=7.8Hz), 10.00 (1H, br. s), 10.15 (1H, br. s), 12.06 (1H, br. s)。

実施例 23

N-〔トランス-4-(N,N-ジメチルカルバモイル)シクロヘキシルメチル〕-〔フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル〕アミン (例示化合物番号 1-1176)

(23a) N-〔トランス-4-(N,N-ジメチルカルバモイル)シクロヘキシルメチル〕-〔フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル〕アミン

参考例 6 で得られた 0.50 g の 2-エチルチオベンゾフェノンと 0.91 g のトランス-4-(N,N-ジメチルカルバモイル)シクロヘキシルメチルアミン塩酸塩を用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 0.67 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.85-1.08 (2H, m), 1.30 (3H, t, J=7.3Hz), 1.45-2.00 (8H, m), 2.35-2.50 (1H, m), 2.46 (2H, d, J=6.3Hz), 2.80-3.00 (2H, m), 2.94 (3H, s), 3.03 (3H, s), 5.36 (1H, s), 7.10-7.55 (9H, m)。

(23b) N-〔トランス-4-(N,N-ジメチルカルバモイル)シクロヘキシルメチル〕-〔フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル〕アミン

実施例 (23a) の N-〔トランス-4-(N,N-ジメチルカルバモイル)シクロヘキシルメチル〕-〔フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル〕アミン 0.60 g、2.4 ml のトリフルオロ酢酸および 0.83 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色柱状晶として 0.36 g 得た。

融点: 154-155℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.85-1.10 (2H, m), 1.15 (3H, t, J=7.4Hz),

1.40-2.00 (8H, m), 2.30-2.60 (3H, m), 2.85-3.10 (2H, m), 2.93 (3H, s), 3.02 (3H, s), 5.94 (1H, s), 7.20-7.50 (6H, m), 7.55-7.65 (1H, m), 7.77 (1H, d, J=7.7Hz), 8.03 (1H, dd, J=1.2Hz, J=7.9Hz)。

実施例 24

N-トランス-4-ヒドロキシメチルシクロヘキシルメチル-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン塩酸塩(例示化合物番号 1-173)

実施例 16 で得られた N-トランス-4-メトキシカルボニルシクロヘキシルメチル-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン 0.50 g を 10 ml の無水テトラヒドロフランに溶解させ、氷冷下、1.8 ml の水素化リチウムアルミニウム-無水テトラヒドロフラン 1 モル溶液を加えて、室温で 4 時間攪拌した。更に氷冷攪拌下、反応液に 1.0 ml の硫酸ナトリウム 10 水和物を加え、30 分攪拌した。不溶物をセライトを用いて濾去し、濾液を減圧留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:シクロヘキサン/酢酸エチル=2~1/1)で分離精製し、無色油状物を 0.32 g 得た。この油状物を 2.0 ml のジオキサンに溶解させ、2.0 ml の 4 規定塩酸/ジオキサン溶液を加え、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をアセトンを用いてろ過し、乾燥させて、標記化合物を無色結晶として 0.22 g 得た。

融点: 182-184℃(分解)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.75-1.10 (4H, m), 1.19 (3H, t, J=7.3Hz), 1.30-1.98 (6H, m), 2.50-3.10 (4H, m), 3.43 (2H, d, J=6.2Hz), 6.70 (1H, br. s), 7.25-7.90 (7H, m), 8.04 (1H, d, J=6.0Hz), 8.46 (1H, d, J=7.8Hz)。

実施例 25

N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩(例示化合物番号 1-447)

実施例 1 で得られた N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H

ーテトラゾールー5-イル) フェニル] メチル} アミンのフリー体 1.45 g を 100 ml の酢酸エチルに加熱溶解させ、2.4 ml の4規定塩酸/酢酸エチルを加え、減圧濃縮した。得られた残渣にイソプロピルエーテルを加えて結晶化させ、濾取し、標記化合物を淡黄色結晶として1.41 g 得た。

融点: 209-211℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.75-0.90 (6H, m), 1.10-1.37 (4H, m), 1.52-1.90 (4H, m), 2.80-2.90 (1H, m), 5.87 (1H, s), 7.30-8.20 (8H, m), 8.52 (1H, s)。

実施例 26

N-シクロヘキシルー{フェニル-[2-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル]メチル}アミン (例示化合物番号 1-125)

(26a) N-シクロヘキシルー{フェニル-[2-(4-メチルチオフェニル)フェニル]メチル}アミン

1.47 g の 2-(4-メチルチオフェニル)ベンゾフェノンと 0.87 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色油状物として1.34 g 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 0.85-1.20 (5H, m), 1.40-1.80 (6H, m), 2.18-2.30 (1H, m), 2.54 (3H, s), 5.14 (1H, s), 7.10-7.60 (13H, m)。

(26b) N-シクロヘキシルー{フェニル-[2-(4-メチルスルホニルフェニル)フェニル]メチル}アミン

実施例(26a)のN-シクロヘキシルー{フェニル-[2-(4-メチルチオフェニル)フェニル]メチル}アミン 462 mg、3.0 ml のトリフルオロ酢酸および 0.5 ml の30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として379 mg 得た。

融点: 116-119℃

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 0.80-1.20 (5H, m), 1.40-1.80 (6H, m), 2.20

-2.35 (1H, m), 3.12 (3H, s), 5.01 (1H, s), 7.05-8.05 (13H, m)。

実施例 27

N-シクロヘキシル-[フェニル-(2-ヒドロキシ-4-メトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-1602)

参考例11で得られた180mgの2-ヒドロキシ-4-メトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルベンゾフェノンと0.135mlシクロヘキシルアミンと触媒量のp-トルエンスルホン酸1水和物を30mlのキシレン中、20時間還流脱水した。反応液に20mlの無水テトラヒドロフランと0.27mlの水素化ホウ素-ジメチルスルヒドコンプレックス10モル溶液を室温に加え、室温で30分撹拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:シクロヘキサン/酢酸エチル=5/1)で分離精製し、無色結晶を得た。この結晶を5.0mlのメタノールに溶解し、1時間加熱還流した。減圧下、溶媒を留去し、酢酸エチルで希釈し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:シクロヘキサン/酢酸エチル=2/1)で分離精製し、標記化合物を無色結晶として12.9mg得た。

融点:168-170℃

NMRスペクトル(CDC1₃) δ ppm: 1.00-1.80 (8H, m), 1.95-2.10 (2H, m), 2.55-2.70 (1H, m), 2.61 (6H, s), 5.60 (1H, s), 6.63 (1H, s), 7.30-7.55 (5H, m), 7.68 (1H, s)。

実施例 28

N-シクロヘキシル-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩(例示化合物番号1-687)

参考例 13 で得られた 948 mg の N-トシル-3-ベンゾイル安息香酸アミドと 0.57 ml シクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 275 mg 得た。

融点: 225-227℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.90-1.75 (8H, m), 2.05-2.20 (2H, m), 2.34 (3H, s), 2.65-2.75 (1H, m), 5.79 (1H, s), 7.24 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 7.30-7.50 (4H, m), 7.60-7.70 (3H, m), 7.76 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.87 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 8.17 (1H, s)。

実施例 29

N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン (例示化合物番号 1-1181)

(29a) N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル]アミン

参考例 6 で得られた 1.0 g の 2-エチルチオベンゾフェノンと 1.1 ml の (R)-1-フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡褐色油状物として 1.41 g 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.07 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 1.18 (1H, t, $J=7.3$ Hz), 1.55-1.75 (4H, m), 2.50-2.83 (2H, m), 5.63 (0.35H, s), 5.68 (0.65H, s), 7.10-7.65 (13H, m), 8.12 (1H, d, $J=7.5$ Hz)。

(29b) N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン

実施例 (29a) の N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル]アミン 1.2 g と 6.0 ml のトリフルオロ酢酸と 1.6 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、無色結晶として標記化合物の異性体 A ($R_f=0.25$ 、シクロヘキサン 4:1 酢酸エチル) を無色針状晶として 0.21 g 得た。異性体 B (

R f = 0.43、シクロヘキサン 4 : 1 酢酸エチル) を無色油状物として 0.54 g 得、この油状物を塩酸塩とし、無色結晶として 0.52 g 得た。

異性体 A

融点 : 113 - 114 °C

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.91 (3H, t, J=7.3Hz), 1.47 (3H, d, J=6.7Hz), 1.69 (1H, br. s), 2.20-2.40 (2H, m), 3.76 (1H, q, J=6.7Hz), 5.82 (1H, s), 7.20-7.67 (12H, m), 7.80-8.00 (2H, m)。

異性体 B

融点 : 203 - 205 °C (分解)

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.84 (3H, t, J=7.3Hz), 1.72 (3H, d, J=6.2Hz), 2.45-2.60 (2H, m), 4.20-4.40 (1H, br. s), 6.42 (1H, br. s), 7.25-8.05 (13H, m), 8.72 (1H, d, J=7.5Hz), 10.15-10.35 (1H, br. s), 11.10-11.35 (1H, br. s)。

実施例 30

N-tert-ブチル- [フェニル- (2-フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-1512)

(30a) N-tert-ブチル- [フェニル- (2-フェニルチオフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

500 mg の 2-フェニルチオベンゾフェノンと 0.36 ml の tert-ブチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 220 mg 得た。

融点 : 178 - 180 °C (分解)

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 1.16 (9H, s), 6.00 (1H, s), 7.20-7.65 (13H, m), 8.13 (1H, d, J=7.9Hz)。

(30b) N-tert-ブチル- [フェニル- (2-フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン塩酸塩

実施例 (30a) の N-tert-ブチル- [フェニル- (2-フェニルチオ

フェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 200 mg と 1.6 ml のトリフルオロ酢酸と 0.3 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 110 mg 得た。

融点: 252-253°C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.23 (9H, s), 6.62 (1H, br. s), 7.20-8.05 (13H, m), 8.88 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 9.64 (1H, br. s, $J=9.6$ Hz), 9.95-10.20 (1H, br. s)。

実施例 31

N-シクロヘキシルー [フェニルー (2-メチルスルホニル-6-メトキシフェニル) メチル] アミンシュウ塩 (例示化合物番号 1-910)

(31a) N-シクロヘキシルー [フェニルー (2-メチルチオ-6-メトキシフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

参考例 14 で得られた 300 mg の 2-メチルチオ-6-メトキシベンゾフェノンと 0.26 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して得たイミノ体を 0.57 ml の水素化ホウ素-ジメチルスルヒドコンプレックス 10 モル溶液を用いて、実施例 27 と同等に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 26 mg 得た。

融点: 173-174°C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.90-2.10 (10H, m), 2.50-2.70 (1H, m), 3.88 (3H, s), 5.82 (1H, s), 7.00-7.60 (8H, m)。

(31b) N-シクロヘキシルー [フェニルー (2-メチルスルホニル-6-メトキシフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

実施例 (31a) の N-シクロヘキシルー [フェニルー (2-メチルチオ-6-メトキシフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 26 mg と 1.0 ml のトリフルオロ酢酸と 0.3 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 11.5 mg 得た。

融点：92-95℃（分解）

NMRスペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.00-1.40 (5H, m), 1.45-2.15 (5H, m), 2.50-2.70 (1H, m), 3.09 (3H, s), 3.83 (3H, s), 6.40-6.80 (1H, br. s), 7.20-7.75 (8H, m)。

実施例 3 2

N - { 4 - (1 - フェニル - 1 - [(N - (1 R) - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル) フェニル } - N' - p - トルエンスルホニルウレア (例示化合物番号 1 - 1 7 9 1)

(3 2 a) N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [4 - N - アセチルアミノ) フェニル] メチル } アミン

1.08 mg の 4 - (N - アセチルアミノ) ベンゾフェノンと 1.15 ml の (R) - 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体混合物を淡黄色泡状物として 1.34 g 得た。

NMRスペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.35 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 2.12 及び 2.15 (合計 3 H, 各々 s), 3.65 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.59 (1H, s), 7.11-7.64 (15H, m)。

(3 2 b) N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - [フェニル - (4 - アミノフェニル) メチル] アミン

実施例 (3 2 a) で得られた N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [4 - N - アセチルアミノ) フェニル] メチル } アミン 1.33 g の 20 ml のメタノール溶液に 5 ml の濃塩酸を加え室温で攪拌した後、1時間加熱還流した。反応液を室温に冷却した後、100 ml の水を加え、塩化メチレンで洗浄した。水層を過剰の重曹で中和した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤 : シクロヘキサン / 酢酸エチル = 5 / 1 ~ 1 / 1) で分離精製し、標記化合物の異性体 A を無色油状物として 350 mg、異性体 B を無色油状物として 380 mg 得た。

異性体 A

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.35 (3H, d, J=6.7Hz), 3.69 (1H, q, J=6.7Hz), 4.53 (1H, s), 6.65 (2H, d, J=8.4Hz), 7.09 (2H, d, J=8.4Hz), 7.11-7.35 (10H, m)

異性体 B

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.35 (3H, d, J=6.7Hz), 3.65 (1H, q, J=6.7Hz), 4.53 (1H, s), 6.56 (2H, d, J=8.5Hz), 7.04 (2H, d, J=8.4Hz), 7.18-7.35 (10H, m)。

(32c) N- { 4 - (1 - フェニル - 1 - [(N - (1 R) - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル) フェニル } - N' - p - トルエンシルホニルウレア

232mg の実施例 (32b) の異性体 A、0.12ml の p - トルエンシルホニルイソシアネートを用いて、実施例 (45a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を黄色粉末として 25.5mg 得た。

異性体 A

融点 : 115 - 118℃ (分解)

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 1.29-1.40 (3H, br. s), 2.37 (3H, s), 3.45-3.75 (1H, m), 4.35-4.80 (1H, m), 7.15-7.41 (16H, m), 7.80 (2H, d, J=8.1Hz), 8.73 (1H, s)

264mg の実施例 (32b) の異性体 B、0.13ml の p - トルエンシルホニルイソシアネートを用いて、実施例 (45a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 B を白色粉末として 55.0mg 得た。

異性体 B

融点 : 101 - 102℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.38 (3H, d, J=6.8Hz), 2.41 (3H, s), 3.68 (1H, q, J=6.7Hz), 4.60 (1H, s), 7.20-7.36 (16H, m), 7.78 (2H, d, J=8.4Hz), 8.38 (1H, br. s)。

実施例 33

N - { 3 - (1 - フェニル - 1 - [(N - (1 R) - 1 - フェニルエチル) ア

ミノ] メチル) フェニル} - N' - p - トルエンスルホニルウレア (例示化合物
番号 1 - 1 7 7 9)

(33a) N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - {フェニル - [3 - N -
アセチルアミノ) フェニル] メチル} アミン

2.0 g の 3 - (N - アセチルアミノ) ベンゾフェノンと 2.13 ml の (R)
- 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精
製して、標記化合物の異性体混合物を淡黄色泡状物として 2.64 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.34 及び 1.35 (合計 3H, 各々 d, J=6.6Hz),
2.07 及び 2.10 (合計 3H, 各々 s), 3.61-3.71 (1H, m), 4.59 及び 4.60 (合計 1H, 各々
s), 7.00-7.67 (15H, m)。

(33b) N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - [フェニル - (3 - アミ
ノフェニル) メチル] アミン

実施例 (32a) で得られた N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - {フェ
ニル - [3 - N - アセチルアミノ) フェニル] メチル} アミン 2.64 g を用い
て、実施例 (32b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を無
色油状物として 287 mg、異性体 B を無色油状物として 265 mg 得た。

異性体 A

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.36 (3H, d, J=6.7Hz), 3.72 (1H, q, J=6.7Hz)
, 4.53 (1H, s), 6.56 (1H, d, J=6.8Hz), 6.67 (1H, s), 6.72 (1H, d, J=7.8Hz), 7.10 (1
H, dd, J=7.8Hz), 7.16-7.36 (10H, m)

異性体 B

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.36 (3H, d, J=6.7Hz), 3.66 (1H, q, J=6.7Hz)
, 4.53 (1H, s), 6.50 (1H, dd, J=1.6Hz, J=7.9Hz), 6.63-6.68 (2H, m), 7.03 (1H, dd, J
=7.7Hz, J=7.8Hz), 7.23-7.36 (10H, m)。

(33c) N - {3 - (1 - フェニル - 1 - [(N - (1R) - 1 - フェニル
エチル) アミノ] メチル) フェニル} - N' - p - トルエンスルホニルウレア

185 mg の実施例 (33b) の異性体 A、0.102 ml の p-トルエンシルホニルイソシアネートを用いて、実施例 (45a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を白色粉末として 70.0 mg 得た。

異性体 A

融点: 111 – 115 °C (軟化)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.40 (3H, d, J=6.5Hz), 2.35 (3H, s), 3.72-3.78 (1H, m), 4.58 (1H, s), 6.91-7.52 (16H, m), 7.83 (2H, d, J=8.2Hz), 8.56 (1H, br. s)

220 mg の実施例 (33b) の異性体 B、0.12 ml の p-トルエンシルホニルイソシアネートを用いて、実施例 (45a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 B を白色粉末として 195 mg 得た。

異性体 B

融点: 107 – 111 °C (軟化)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.40 (3H, d, J=6.1Hz), 2.38 (3H, s), 3.65-3.75 (1H, m), 4.59 (1H, s), 6.92-7.48 (16H, m), 7.81 (2H, br. s), 8.56 (1H, br. s)

実施例 34

N-シクロヘキシル- [フェニル- (2, 4-ジメトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1876)

参考例 28 で得られた 410 mg の 2, 4-ジメトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルベンゾフェノンと 0.61 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して得たイミノ体 45 mg と 0.0145 ml の水素化ホウ素-ジメチルスルフィドコンプレックス 10 M 溶液を用いて、実施例 27 と同様に反応させ、精製して、標記化合物のフリー体を黄色泡状物として 41.2 mg 得た。このフリー体を用いてシュウ酸塩とし、標記化

物を白色粉末として 18.2 mg 得た。

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.99-1.19 (3H, m), 1.20-1.40 (2H, m), 1.48-1.58 (1H, m), 1.65-1.78 (2H, m), 1.95-2.13 (2H, m), 2.50-2.70 (1H, m), 2.65 (6H, s), 3.93 (3H, s), 3.96 (3H, s), 5.71 (1H, br. s), 6.84 (1H, s), 7.29-7.58 (5H, m), 7.95 (1H, s),

実施例 35

N-シクロヘキシル-[1-ナフチル-(2-メチルスルホニルフェニル)メチル]アミン (例示化合物番号 2-290)

(35a) N-シクロヘキシル-[1-ナフチル-(2-メチルチオフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

参考例 15 で得られた 2.34 g の 2-N-メチルチオフェニル-(1-ナフチル)ケトンと 1.92 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色結晶として 2.73 g 得た。

融点: 189-191°C (分解)

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.30 (4H, m), 1.45-1.90 (5H, m), 2.10-2.30 (2H, m), 2.67 (3H, s), 3.05-3.20 (1H, m), 6.74 (1H, s), 6.95-8.15 (11H, m)。

(35b) N-シクロヘキシル-[1-ナフチル-(2-メチルスルホニルフェニル)メチル]アミン

実施例 (35a) の N-シクロヘキシル-[1-ナフチル-(2-メチルチオフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩 2.73 g、15 ml のトリフルオロ酢酸および 3.0 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶と 363 mg 得た。

融点: 139-141°C

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.80 (9H, m), 1.85-2.20 (2H, m), 2.55-2.70 (1H, m), 2.83 (3H, s), 7.16 (1H, d, J=7.1 Hz), 7.20-7.90 (8H, m), 8.15 (1H, dd, J=1.2 Hz, J=7.9 Hz), 8.34 (1H, d, J=8.3 Hz)。

実施例 3 6

N - ((1 R) - 1 - シクロヘキシルエチル) - { フェニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 5 1 5)

(3 6 a) N - ((1 R) - 1 - シクロヘキシルエチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン

5 0 0 m g の 3 - シアノベンゾフェノンと 0 . 7 1 m l の (R) - 1 - シクロヘキシルエチルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色油状物として 5 5 7 m g 得た。

N M R スペクトル (C D C l ₃) δ ppm : 0.94-1.26 (9H, m), 1.47-1.71 (5H, m), 2.28-2.44 (1H, m), 4.97 (1H, s), 7.22-7.77 (9H, m)。

(3 6 b) N - ((1 R) - 1 - シクロヘキシルエチル) - { フェニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン

実施例 (3 6 a) の N - ((1 R) - 1 - シクロヘキシルエチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン 5 5 0 m g 、 3 3 7 m g のナトリウムアジドおよび 1 . 4 0 m l のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 1 3 2 m g 得た。

融点 : 2 1 6 - 2 1 8 °C

N M R スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.94-1.26 (8H, m), 1.47-1.71 (6H, m), 2.53-2.56 (1H, m), 5.39 (1H, m), 7.25-7.60 (7H, m), 7.89 (1H, d, J=7.7Hz), 8.24 (1H, d, J=6.0Hz)。

実施例 3 7

N - (1 - エチルペンチル) - { フェニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 5 3 0)

(3 7 a) N - (1 - エチルペンチル) - [フェニル - (4 - シアノフェニル) メチル] アミン

1.0 g の 4-シアノベンゾフェノンと 1.46 g の 1-エチルペンチルアミン塩酸塩を用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 1.44 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.75-0.95 (6H, m), 1.15-1.55 (9H, m), 2.30-2.42 (1H, m), 4.98 (1H, s), 7.10-7.60 (9H, m)。

(37b) N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン

実施例 (37a) の N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン 1.16 g、0.74 g のナトリウムアジドおよび 3.1 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 687 mg 得た。

融点: 219-221°C

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.75-0.95 (6H, m), 1.10-1.60 (8H, m), 2.40-2.55 (1H, m), 5.26 (1H, s), 7.20-7.45 (3H, m), 7.54 (2H, d, J=7.7Hz), 7.66 (2H, d, J=7.3Hz), 7.98 (2H, d, J=8.2Hz)。

実施例 38

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-1138)

(38a) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

参考例 6 で得られた 0.50 g の 2-エチルチオベンゾフェノンと 0.63 g の 1-エチルペンチルアミン塩酸塩を用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、得た 0.59 g の黄色油状物をシュウ酸塩として、標記化合物を無色結晶として 0.47 g 得た。

融点: 131-133°C

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.82-1.05 (6H, m), 1.20-1.45 (7H, m), 1.65

-1.95 (4H, m), 2.85-3.05 (3H, m), 6.07 (1H, s), 7.20-7.70 (9H, m)。

(38b) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-エチルスルホニルフェニル)メチル]アミン塩酸塩

実施例(38a)のN-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(2-エチルチオフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩0.45gと、2.5mlのトリフルオロ酢酸および0.6mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として0.35g得た。

融点: 176-178℃(分解)

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm: 0.80-1.40 (13H, m), 1.55-2.00 (4H, m), 3.05-3.30 (2H, m), 6.81 (1H, s), 7.20-7.50 (6H, m), 7.60-7.70 (1H, m), 7.93 (1H, d, $J=6.9$ Hz), 8.02 (1H, dd, $J=1.2$ Hz, $J=7.9$ Hz)。

実施例39

N-シクロヘキシル-[フェニル-[2-(2-メチルスルホニルフェニル)フェニル]メチル]アミン(例示化合物番号1-87)

(39a) N-シクロヘキシル-[フェニル-[2-(2-メチルスルホニルフェニル)フェニル]メチル]アミンシュウ酸塩

参考例17で得られた0.99gの2-(2-メチルチオフェニル)ベンゾフェノンと0.76mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として925mg得た。

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm: 0.90-2.15 (11H, m), 2.40 (3H, s), 2.85-3.00 (1H, m), 5.11 (1H, s), 6.74 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.10-7.70 (11H, m), 8.08 (1H, d, $J=7.7$ Hz)。

(39b) N-シクロヘキシル-[フェニル-[2-(2-メチルスルホニルフェニル)フェニル]メチル]アミン

実施例(39a)のN-シクロヘキシル-[フェニル-[2-(2-メチルチオフェニル)フェニル]メチル]アミンシュウ酸塩925mg、10mlのトリ

フルオロ酢酸および 3.0 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡桃色結晶として 70 mg 得た。

融点: 137 - 138 °C

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.80-1.25 (6H, m), 1.30-1.95 (5H, m), 2.15-2.30 (1H, m), 2.90 (3H, s), 4.87 (1H, s), 6.94 (1H, d, J=7.5Hz), 7.03-7.75 (10H, m), 7.95 (1H, d, J=7.8Hz), 8.31 (1H, d, J=7.9Hz)。

実施例 40

N-シクロヘキシル- {フェニル- [4- (2-メチルスルホニルフェニル) フェニル] メチル} アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-176)

(40a) N-シクロヘキシル- {フェニル- [4- (2-メチルチオフェニル) フェニル] メチル} アミン

参考例 18 で得られた 0.93 g の 4- (2-メチルチオフェニル) ベンゾフェノンと 0.71 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 1.14 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.30 (6H, m), 1.50-1.75 (3H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.35 (3H, s), 2.35-2.50 (1H, m), 5.08 (1H, s), 7.10-7.50 (13H, m)。

(40b) N-シクロヘキシル- {フェニル- [4- (2-メチルスルホニルフェニル) フェニル] メチル} アミンシュウ酸塩

実施例 (40a) の N-シクロヘキシル- {フェニル- [4- (2-メチルチオフェニル) フェニル] メチル} アミン 1.12 g、5.0 ml のトリフルオロ酢酸および 1.0 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 1.26 g 得た。

融点: 217 - 219 °C

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 1.05-2.30 (10H, m), 2.65-2.80 (1H, m), 2.89 (3H, s), 5.76 (1H, s), 7.40-7.90 (12H, m), 8.16 (1H, d, J=7.6Hz)。

実施例 4 1

N-n-ブチル-〔フェニル- (2-ブチルスルホニルフェニル) メチル〕 アミンシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-1410)

(41a) N-n-ブチル-〔フェニル- (2-ブチルチオフェニル) メチル〕 アミンシュウ酸塩

500 mg の 2-n-ブチルチオベンゾフェノンと 0.37 ml の n-ブチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、淡褐色油状物を 570 mg 得た。得られた油状物 533 mg とシュウ酸 146 mg を用いて、標記化合物を無色結晶として 367 mg 得た。

融点: 151-153℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.79 (3H, t, J=7.3Hz), 0.88 (3H, t, J=7.3Hz), 1.10-1.65 (8H, m), 2.72-2.96 (4H, m), 6.07 (1H, s), 7.15-7.60 (8H, m), 7.90-8.00 (1H, m)。

(41b) N-n-ブチル-〔フェニル- (2-ブチルスルホニルフェニル) メチル〕 アミンシュウ酸塩

実施例 (41a) の N-n-ブチル-〔フェニル- (2-ブチルチオフェニル) メチル〕 アミンシュウ酸塩 360 mg を重曹水で中和し、得た 281.2 mg の N-n-ブチル-〔フェニル- (2-ブチルチオフェニル) メチル〕 アミンと 2.0 ml のトリフルオロ酢酸と 0.5 ml の 30% 過酸化水素水を用いて、実施例 (2b) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 342 g 得た。

融点: 111-113℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.77 (3H, t, J=7.3Hz), 0.81 (3H, t, J=7.3Hz), 1.08-1.35 (4H, m), 1.35-1.70 (4H, m), 2.55-3.05 (4H, m), 6.59 (1H, s), 7.25-7.80 (7H, m), 8.04 (1H, d, J=7.9Hz), 8.16 (1H, d, J=7.6Hz)。

実施例 4 2

N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1 - 4 8 9)

(4 2 a) N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン

6 2 1 m g の 3 - シアノベンゾフェノンと 0 . 7 7 m l の (R) - 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を淡黄色油状物として 2 9 3 m g 、異性体 B を淡黄色油状物として 3 2 8 m g 得た。

異性体 A

N M R スペクトル (C D C l ₃) δ ppm : 1.38 (3 H , d , J = 6.7 Hz) , 3.59 (1 H , q , J = 6.7 Hz , J = 13.3 Hz) , 4.64 (1 H , s) , 7.10 - 7.65 (13 H , m) , 7.72 (1 H , s) .

異性体 B

N M R スペクトル (C D C l ₃) δ ppm : 1.37 (3 H , d , J = 6.6 Hz) , 3.66 (1 H , q , J = 6.6 Hz , J = 13.2 Hz) , 4.61 (1 H , s) , 7.15 - 7.55 (13 H , m) , 7.65 (1 H , s) .

(4 2 b) N - ((1 R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン塩酸塩

2 9 3 m g の実施例 (4 2 a) の異性体 A と 1 8 3 m g のナトリウムアジドと 0 . 8 1 m l のトリ - n - ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を無色結晶として 1 0 2 m g 得た。

異性体 A

融点 : 2 4 7 - 2 4 9 ° C (分解)

N M R スペクトル (d₆ - DMSO) δ ppm : 1.69 (3 H , d , J = 6.7 Hz) , 4.05 - 4.20 (1 H , m) , 5.46 (1 H , s) , 7.30 - 8.10 (13 H , m) , 8.34 (1 H , s) .

3 2 8 m g の実施例 (4 2 a) の異性体 B と 2 0 4 m g のナトリウムアジドと 0 . 9 0 m l のトリ - n - ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応

させ、精製して、標記化合物の異性体Bを無色結晶として143mg得た。

異性体B

融点：174℃（分解）

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.70 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 4.10-4.25 (1H, m), 5.30 (1H, s), 7.30-8.10 (13H, m), 8.33 (1H, s)。

実施例43

N-((1R)-1-フェニルエチル)-{フェニル-(3-[2-(2-メチルフェニル)フェニルスルホニルカルバモイル]フェニル)メチル}アミン塩酸塩（例示化合物番号1-802）

(43a) N-((1R)-1-フェニルエチル)-{フェニル-(3-[2-(2-メチルフェニル)フェニルスルホニルカルバモイル]フェニル)メチル}アミン

参考例19で得られたN-[2-(2-メチルフェニル)フェニルスルホニル]-3-ベンゾイルベンズアミド250mgと0.14mlの(R)-1-フェニルエチルアミンを用いて実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Aを無色油状物として100mg、異性体Bを無色泡状物として53mg得た。

異性体A

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm : 1.37 (3H, d, $J=6.2$ Hz), 1.82 (1.2H, s), 1.85 (1.8H, s), 3.50-3.70 (1H, m), 4.63 (1H, s), 6.80-7.75 (22H, m), 8.42 (1H, d, $J=7.2$ Hz)。

異性体B

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm : 1.37 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 1.87 (1.4H, s), 1.90 (1.6H, s), 3.66 (1H, q, $J=6.7$ Hz, $J=13.3$ Hz), 4.61 (1H, s), 6.85-7.70 (22H, m), 8.40 (1H, d, $J=8.1$ Hz)。

(43b) N-((1R)-1-フェニルエチル)-{フェニル-(3-[2

－（２－メチルフェニル）フェニルスルホニルカルバモイル］フェニル）メチル
｝アミン塩酸塩

実施例（４３ａ）の異性体Ａ１００ｍｇを２．０ｍｌの酢酸エチルに溶解させ、０．０４５ｍｌの４規定塩酸／ジオキサン溶液を加え、減圧濃縮した。得られた残査を０．５ｍｌの酢酸エチルに溶解させ、更に、１０ｍｌのエーテルを加え、標記化合物を淡黄色結晶として５１ｍｇ得た。

実施例（４３ａ）の異性体Ｂ５０ｍｇと０．０２２ｍｌの４規定塩酸／ジオキサン溶液から、同様にして、標記化合物を淡黄色結晶として３０ｍｇ得た。

異性体Ａ

融点：１７２－１７５℃

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.67(3H, d, $J=6.5$ Hz), 1.85(1.7H, s), 1.89(1.3H, s), 4.00-4.20(1H, m), 5.36(1H, s), 6.83-8.20(22H, m), 9.90-10.15(1H, m), 10.30-10.55(1H, m), 12.14(1H, br. s)。

異性体Ｂ

融点：１７２－１７５℃

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.67(3H, d, $J=6.6$ Hz), 1.85(1.5H, s), 1.86(1.5H, s), 4.05-4.20(1H, m), 5.17(1H, s), 6.85-8.20(22H, m), 10.00-10.20(1H, m), 10.50-10.70(1H, m), 12.11(1H, br. s)。

実施例４４

N－（（１Ｒ）－１－フェニルエチル）－［フェニル－（２－ブチルスルホニルフェニル）メチル］アミン塩酸塩（例示化合物番号１－１４５６）

（４４ａ）N－（（１Ｒ）－１－フェニルエチル）－［フェニル－（２－ブチルチオフェニル）メチル］アミン

６６８ｍｇの２－*n*－ブチルチオベンゾフェノンと０．６３ｍｌの（Ｒ）－１－フェニルエチルアミンを用いて、実施例（２ａ）と同様に反応させ、精製して、淡褐色油状物を９１９ｍｇ得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 0.87 (3H, m), 1.20-1.55 (7H, m), 2.62-2.80 (2H, m), 3.60-3.80 (1H, m), 5.21 (0.5H, s), 5.36 (0.5H, s), 7.10-7.70 (14H, m)。

(44b) N-(1R)-1-フェニルエチル-[フェニル-(2-ブチルスルホニルフェニル)メチル]アミン塩酸塩

908mgの実施例(44a)のN-(1R)-1-フェニルエチル-[フェニル-(2-ブチルチオフェニル)メチル]アミンと1.5mlのトリフルオロ酢酸と4.0mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Aを無色結晶として402mg、異性体Bを201mg得た。

異性体A

融点: 135℃ (分解)

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 0.57 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 0.80-1.35 (7H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 3.90-4.05 (1H, m), 6.43 (1H, br. s), 7.10-8.00 (13H, m), 8.75-8.90 (1H, m)。

異性体B

融点: 209℃ (分解)

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 0.94 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.25-1.65 (4H, m), 1.73 (3H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 2.65-2.98 (2H, m), 4.20-4.35 (1H, m), 6.32 (0.5H, s), 6.35 (0.5H, s), 7.30-7.95 (13H, m), 8.64 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$)。

実施例 45

N-{2-[1-フェニル-1-(N-(1R)-1-フェニルエチル)アミノ]メチル}フェニル-N'-トシルウレアシュウ酸塩 (例示化合物番号 1-11739)

(45a) N-(2-ベンゾイルフェニル)-N'-トシルウレア

500mgの2-アミノベンゾフェノンと0.385mlのp-トルエンスル

ホニルイソシアネートを20mlの無水ベンゼンに溶解し、4時間加熱還流した後、反応液を100mlの酢酸エチルで希釈し、10%塩酸水、飽和食塩水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝3／1）で分離精製し、標記化合物を淡黄色泡状物として600mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 2.37(3H, s), 7.05-8.00(14H, m)。

(45b) N-〔2-〔1-フェニル-1-(N-(1R)-1-フェニルエチル)アミノ〕メチル〕フェニル-N'-トシルウレアシュウ酸塩

600mgの実施例(45a)のN-(2-ベンゾイルフェニル)-N'-トシルウレアと0.39mlの(R)-1-フェニルエチルアミンを用いて実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Aを淡黄色結晶として85.9mg、異性体Bをシュウ酸塩とし、淡黄色結晶として24mg得た。

異性体A

融点：134-136℃

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.46(3H, d, J=6.7Hz), 2.44(3H, s), 3.62(1H, q, J=6.7Hz, J=13.5Hz), 4.70(1H, s), 6.90-7.90(18H, m)。

異性体B

融点：127-129℃（分解）

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.40(3H, d, J=2.7Hz), 2.39(3H, s), 3.60-3.75(1H, m), 4.76(1H, s), 6.90-7.90(18H, m)。

実施例46

N-((1R)-1-フェニルエチル)-〔2-ベンゾチアゾリル-〔3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル〕メチル〕アミン（例示化合物番号3-470）

(46a) N-((1R)-1-フェニルエチル)-〔2-ベンゾチアゾリル

- (3-シアノフェニル) メチル] アミン

参考例 20 で得られた 530 mg の (2-ベンゾチアゾリル) - 3-シアノフェニルケトンと 0.51 ml の (R) - 1-フェニルエチルアミンとから、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色泡状物として 685 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 1.35-1.55 (3H, m), 3.71 (0.4H, q, $J=6.7\text{Hz}$, $J=13.3\text{Hz}$), 3.91 (0.6H, q, $J=6.7\text{Hz}$, $J=13.3\text{Hz}$), 5.05 (0.4H, s), 5.08 (0.6H, s), 7.10-8.10 (13H, m)。

- (46b) N - ((1R) - 1-フェニルエチル) - { 2-ベンゾチアゾリル - [3 - (1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル } アミン

実施例 (46a) の N - ((1R) - 1-フェニルエチル) - [2-ベンゾチアゾリル - (3-シアノフェニル) メチル] アミン 384 mg と 203 mg のナトリウムアジドと 0.89 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 63 mg 得た。

融点 : 177 - 178 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.30-1.50 (3H, m), 3.60-4.00 (1H, m), 5.00 (0.4H, s), 5.04 (0.6H, s), 7.20-8.15 (14H, m)。

実施例 47

N-シクロヘキシル - [フェニル - (2-n-プロピルスルホニルフェニル) メチル] アミン (例示化合物番号 1-1385)

(47a) N-シクロヘキシル - [フェニル - (2-n-プロピルチオフェニル) メチル] アミン

0.5 g の 2-n-プロピルチオベンゾフェノンと 0.5 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄褐色油状物として 0.58 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 1.0 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 0.97-1.29 (5H, m), 1.

4.3-1.71 (6H, m), 1.93-2.04 (2H, m), 2.36-2.44 (1H, m), 2.85-2.90 (2H, m), 5.64 (1H, s), 7.13-7.55 (9H, m)。

(47b) N-シクロヘキシル-[フェニル-(2-n-プロピルスルホニルフェニル)メチル]アミン

実施例(47a)のN-シクロヘキシル-[フェニル-(2-n-プロピルチオフェニル)メチル]アミン0.56g、2.4mlのトリフルオロ酢酸および0.93mlの30%過酸化水素水を用いて、実施例(2b)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として0.25g得た。

融点: 62-64℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm: 0.74 (3H, t, J=7.5Hz), 0.98-1.69 (5H, m), 1.69-1.73 (6H, m), 1.73-2.06 (2H, m), 2.37-2.46 (1H, m), 2.66 (2H, m), 6.29 (1H, s), 7.20-8.04 (9H, m)。

実施例48

N-シクロヘキシル-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩(例示化合物番号1-552)

(48a) N-シクロヘキシル-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン

361mgの4-シアノベンゾフェノンと0.40mlのシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として562mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm: 1.00-1.30 (5H, m), 1.40-2.00 (6H, m), 2.30-2.40 (1H, m), 5.07 (1H, s), 7.15-7.65 (9H, m)。

(48b) N-シクロヘキシル-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩

実施例(48a)のN-シクロヘキシル-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン546mg、366mgのナトリウムアジドおよび1.61m

1 のトリ-*n*-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 319 mg 得た。

融点：275 - 277 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.00-1.80 (6H, m), 1.62-1.82 (2H, m), 2.14-2.30 (2H, m), 2.70-2.90 (1H, m), 5.88 (1H, s), 7.30-7.60 (3H, m), 7.70-7.80 (2H, m), 7.90-8.03 (2H, m), 8.10-8.20 (2H, m), 9.72 (1H, br. s)。

実施例 49

N-シクロヘキシル- {フェニル- [3- (1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-469)

(49a) N-シクロヘキシル- [フェニル- (3-シアノフェニル) メチル] アミン

414 mg の 3-シアノベンゾフェノンと 0.46 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 531 mg 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.00-2.00 (10H, m), 2.30-2.40 (1H, m), 5.10 (1H, s), 7.20-8.20 (9H, m)。

(49b) N-シクロヘキシル- {フェニル- [3- (1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン塩酸塩

実施例 (49a) の N-シクロヘキシル- [フェニル- (3-シアノフェニル) メチル] アミン 531 mg、355 mg のナトリウムアジドおよび 1.56 ml のトリ-*n*-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 453 mg 得た。

融点：272 - 273 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.00-1.20 (2H, m), 1.30-1.80 (6H, m), 2.15-2.40 (2H, m), 2.70-2.90 (1H, m), 5.91 (1H, s), 7.30-7.90 (6H, m), 8.00-8.15 (2H, m), 8.45-8.50 (1H, m)。

実施例 50

N-(1-エチルプロピル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩(例示化合物番号1-513)

(50a) N-(1-エチルプロピル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン

414mgの3-シアノベンゾフェノンと0.24mlの3-アミノペンタンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として302mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.80-0.95(6H, m), 1.35-1.60(4H, m), 2.27-2.40(1H, m), 4.96(1H, s), 7.20-7.80(9H, m)。

(50b) N-(1-エチルプロピル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩

実施例(50a)のN-(1-エチルプロピル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン289mg、202mgのナトリウムアジドおよび0.89mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として83mg得た。

融点: 229-232℃(分解)

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 0.75-0.95(6H, m), 1.60-2.00(4H, m), 2.70-2.90(1H, m), 5.88(1H, s), 7.30-7.52(3H, m), 7.60-7.90(3H, m), 8.00-8.10(2H, m), 8.50-8.55(1H, m)。

実施例 51

N-((1R)-1-シクロヘキシルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン(例示化合物番号1-598)

(51a) N-((1R)-1-シクロヘキシルエチル)-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン

500 mg の 4-シアノベンゾフェノンと 0.71 ml の (R)-1-シクロヘキシルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を淡黄色油状物として 182 mg、異性体 B を淡黄色油状物として 312 mg を得た。

異性体 A

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.94-1.36 (9H, m), 1.61-1.81 (5H, m), 2.27-2.36 (1H, m), 5.00 (1H, s), 7.25-7.33 (5H, m), 7.54-7.61 (4H, m)

異性体 B

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 0.91-1.40 (9H, m), 1.62-1.77 (5H, m), 2.35-2.44 (1H, m), 4.98 (1H, s), 7.19-7.36 (5H, m), 7.52-7.59 (4H, m)。

(51b) N-((1R)-1-シクロヘキシルエチル) - {フェニル [4-(1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン塩酸塩

177 mg の実施例 (51a) の異性体 A、109 mg のナトリウムアジドおよび 0.46 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A の塩酸塩を無色結晶として 149 mg 得た。

異性体 A

融点 : 243-245℃ (分解)

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 0.91-1.36 (6H, m), 1.61-1.82 (4H, m), 1.91-2.02 (1H, m), 2.87-2.90 (1H, m), 5.81 (1H, s), 7.35-7.48 (3H, m), 7.85 (2H, d, J=7.2Hz), 8.03 (2H, d, J=8.3Hz), 8.15 (2H, d, J=8.3Hz), 9.37-9.89 (2H, m) 。

306 mg の実施例 (51a) の異性体 B、250 mg のナトリウムアジドおよび 1.04 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 B を無色結晶として 185 mg 得た。

異性体 B

融点 : 235-238℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.89-1.38 (9H, m), 1.45-2.56 (6H, m), 5.27 (1H, s), 7.26-7.39 (3H, m), 7.53 (2H, d, $J=7.2$ Hz), 7.66 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.98 (2H, d, $J=8.3$ Hz)。

実施例 5 2

N - [(1 R) - 1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { フェニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 6 0 0)

(5 2 a) N - [(1 R) - 1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - [フェニル - (4 - シアノフェニル) メチル] アミン

5 1 8 m g の 4 - シアノベンゾフェノンと 1 g の (R) - 1 - (4 - ブロモフェニル) エチルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を無色結晶として 3 4 7 m g、異性体 B を淡黄色油状物として 2 6 6 m g を得た。

異性体 A

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.35 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.57 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.62 (1H, s), 7.07 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.19-7.28 (5H, m), 7.46 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.62 (2H, d, $J=8.3$ Hz)

異性体 B

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.34 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.64 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.59 (1H, s), 7.13 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.48 (9H, m), 7.53 (2H, d, $J=8.3$ Hz)。

(5 2 b) N - [(1 R) - 1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { フェニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン

2 4 7 m g の実施例 (5 2 a) の異性体 A、1 2 3 m g のナトリウムアジドおよび 0.5 1 m l のトリ - n - ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を無色結晶として 1 3 5 m g 得た。

異性体 A

融点：231-233℃

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.31 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.56 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.61 (1H, s), 7.16-7.37 (7H, m), 7.50-7.60 (4H, m), 8.00 (2H, d, $J=8.3$ Hz)。

261mgの実施例(52a)の異性体B、131mgのナトリウムアジドおよび0.55mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Bを淡黄色結晶として43mg得た。

異性体B

融点：230-232℃

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.31 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.56 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.61 (1H, s), 7.21-7.40 (7H, m), 7.50-7.57 (4H, m), 7.92 (2H, d, $J=8.2$ Hz)。

実施例53

N-((1S)-1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン(例示化合物番号1-572)

(53a) N-((1S)-1-フェニルエチル)-[(4-シアノフェニル)フェニルメチル]アミン

1gの4-シアノベンゾフェノンと1.22mlの(S)-1-フェニルエチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Aを淡黄色油状物として413mg、異性体Bを淡黄色油状物として155mgを得た。

異性体A

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm : 1.38 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.60 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.65 (1H, s), 7.14-7.38 (10H, m), 7.49 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.61 (2H, d, $J=8.3$ Hz)

異性体B

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm : 1.37 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.67 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.64 (1H, s), 7.21-7.38 (10H, m), 7.41 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.52 (2H, d, $J=8.4$ Hz)。

(53b) N-((1S)-1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1

H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン

395 mg の実施例 (53a) の異性体 A、246 mg のナトリウムアジドおよび 1.03 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を無色結晶として 383 mg 得た。

異性体 A

融点: 200-202℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.34 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.60 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.67 (1H, s), 7.16-7.38 (10H, m), 7.58 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 7.99 (2H, d, $J=8.2$ Hz)。

145 mg の実施例 (53a) の異性体 B、91 mg のナトリウムアジドおよび 0.38 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 B を無色結晶として 129 mg 得た。

異性体 B

融点: 222-224℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.34 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.59 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.65 (1H, s), 7.21-7.41 (10H, m), 7.54 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.93 (2H, d, $J=8.3$ Hz)。

実施例 54

N-(1-メチルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル) フェニル] メチル} アミン塩酸塩 (例示化合物番号 1-442)

(54a) N-(1-メチルエチル)-[フェニル-(3-シアノフェニル) メチル] アミン

2.07 g の 3-シアノベンゾフェノンと 4.3 ml のイソプロピルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 1.65 g 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.00-1.16 (6H, m), 2.60-2.80 (1H, m), 4.98

(1H, s), 7.20-7.80 (9H, m)。

(54b) N-(1-メチルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩

実施例(54a)のN-(1-メチルエチル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン1.64g、1.28gのナトリウムアジドおよび3.74mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として112mg得た。

融点: 273-275℃(分解)

NMRスペクトル(d_6 -DMSO) δ ppm : 1.20-1.30 (6H, m), 3.00-3.20 (1H, m), 5.87 (1H, s), 7.35-7.50 (3H, m), 7.65-7.85 (3H, m), 7.95-8.10 (2H, m), 8.45-8.50 (1H, m)。

実施例55

N-t-ブチル-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩(例示化合物番号1-444)

(55a) N-t-ブチル-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン

414mgの3-シアノベンゾフェノンと1.05mlのt-ブチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として132mg得た。

NMRスペクトル($CDCl_3$) δ ppm : 1.05 (9H, s), 5.02 (1H, s), 7.15-7.50 (7H, m), 7.63-7.72 (1H, m), 7.84-7.90 (1H, m)。

(55b) N-t-ブチル-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩

実施例(55a)のN-t-ブチル-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン119mg、176mgのナトリウムアジドおよび0.52mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して

、標記化合物を無色結晶として 9.2 mg 得た。

融点：262-264℃（分解）

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.29 (9H, s), 5.89 (1H, s), 7.30-7.50 (3H, m), 7.60-7.72 (1H, m), 7.85-8.06 (3H, m), 8.10-8.22 (1H, m), 8.54-8.63 (1H, m)

実施例 56

N-((1S)-1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩（例示化合物番号 1-489）

(56a) N-((1S)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン

621 mg の 3-シアノベンゾフェノンと 0.77 ml の (S)-1-フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を淡黄色油状物として 331 mg、異性体 B を無色結晶として 333 mg を得た。

異性体 A

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.38 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.59 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.64 (1H, s), 7.10-7.65 (13H, m), 7.72 (1H, s)

異性体 B

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.37 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.66 (1H, q, $J=6.6$ Hz), 4.61 (1H, s), 7.15-7.55 (13H, m), 7.65 (1H, s)。

(56b) N-((1S)-1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン塩酸塩

321 mg の実施例 (56a) の異性体 A、200 mg のナトリウムアジドおよび 0.88 ml のトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A の塩酸塩を無色結晶として 147 mg

g 得た。

異性体 A

融点：241 - 244 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.69 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 4.05-4.20 (1H, m), 5.46 (1H, s), 7.30-8.10 (13H, m), 8.34 (1H, s)。

312 mg の実施例 (56a) の異性体 B、195 mg のナトリウムアジドおよび 0.86 ml のトリ-*n*-ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 B を無色結晶として 179 mg 得た。

異性体 B

融点：168 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.70 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 4.10-4.25 (1H, m), 5.30 (1H, m), 7.30-8.10 (13H, m), 8.33 (1H, m)。

実施例 57

N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - { フェニル - [4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 572)

(57a) N - ((1R) - 1 - フェニルエチル) - [フェニル - (4 - シアノフェニル) メチル] アミン

1 g の 4 - シアノベンゾフェノンと 1.22 ml の (R) - 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体 A を淡黄色油状物として 197 mg、異性体 B を淡黄色油状物として 165 mg を得た。

異性体 A

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.38 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 3.59 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 4.65 (1H, s), 7.17-7.38 (10H, m), 7.49 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 7.61 (2H, d, $J=8.2$ Hz)

異性体 B

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.37 (3H, d, $J=6.6$ Hz), 3.67 (1H, q, $J=6.6$ Hz)

4.64 (1H, s), 7.23-7.38 (10H, m), 7.41 (2H, d, J=8.2Hz), 7.52 (2H, d, J=8.2Hz)。

(57b) N-((1R)-1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン

193mgの実施例(57a)の異性体A、120mgのナトリウムアジドおよび0.5mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Aの塩酸塩を無色結晶として185mg得た。

異性体A

融点: 222-229℃ (分解)

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 1.86 (3H, d, J=6.7Hz), 4.12 (1H, m), 4.77 (1H, s), 7.13 (3H, m), 7.34-7.52 (7H, m), 7.92 (2H, d, J=8.2Hz), 8.44 (2H, d, J=8.2Hz), 10.20-10.43 (1H, m), 11.13-11.36 (1H, m)。

160mgの実施例(57a)の異性体B、99mgのナトリウムアジドおよび0.42mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物の異性体Bを無色結晶として18mg得た。

異性体B

融点: 226℃-228℃ (分解)

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.34 (3H, d, J=6.6Hz), 3.59 (1H, q, J=6.6Hz), 4.65 (1H, s), 7.23-7.40 (10H, m), 7.54 (2H, d, J=8.2Hz), 7.93 (2H, d, J=8.2Hz)。

実施例58

N-((1R)-1-ナフチルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン (例示化合物番号1-606)

(58a) N-((1R)-1-ナフチルエチル)-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン

500mgの4-シアノベンゾフェノンと0.77mlの(R)-1-ナフチ

ルエチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として885mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 1.49-1.54 (3H, m), 4.47-4.58 (1H, m), 4.72 及び 4.75 (合計1H, 各々s), 7.18-7.67 (13H, m), 7.77-7.94 (3H, m)。

(58b) N-((1R)-1-ナフチルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン

実施例(58a)のN-((1R)-1-ナフチルエチル)-[フェニル-(4-シアノフェニル)メチル]アミン880mg、468mgのナトリウムアジドおよび1.95mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として177mg得た。

融点: 204-206℃ (分解)

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.47 (3H, d, J=6.5Hz), 4.49 (1H, q, J=6.5Hz), 4.79 (1H, s), 7.24-7.62 (10H, m), 7.78-7.84 (3H, m), 7.91-7.96 (3H, m)。

実施例59

N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-メシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン塩酸塩 (例示化合物番号1-640)

248mgのN-メシル-3-ベンゾイル安息香酸アミドと0.21mlの((1R)-1-フェニルエチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として190mg得た。

融点: 148-152℃

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.65-1.75 (3H, m), 3.35 (3H, s), 4.10 (1H, s), 5.20 及び 5.35 (合計1H, 各々s), 7.30-8.20 (14H, m)。

実施例60

N-((1R)-1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン塩酸塩 (例示化合物番号1-696)

478mgのN-トシル-3-ベンゾイル安息香酸アミドと0.32mlの((1R)-1-フェニルエチルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として190mg得た。

R) - 1 - フェニルエチルアミンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物のフリー体の異性体 A を淡黄色油状物として 189 mg、異性体 B を淡黄色油状物として 218 mg を得た。

異性体 A 117 mg を用い、標記化合物を塩酸塩として 99 mg 得、同様に異性体 B 132 mg を用い、標記化合物を塩酸塩として 115 mg 得た。

異性体 A

融点 : 147 - 149 °C

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.69 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 2.40 (3H, s), 4.00 - 4.15 (1H, m), 5.33 (1H, s), 7.25-8.10 (18H, m)

異性体 B

融点 : 144 - 146 °C

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.68 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 2.40 (3H, s), 4.00 - 4.20 (1H, m), 5.20 (1H, s), 7.22-8.10 (18H, m)。

実施例 6 1

N - ((1R) - インダン - 1 - イル) - { フェニル - [4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 568)

(61a) N - ((1R) - インダン - 1 - イル) - [フェニル - (4 - シアノフェニル) メチル] アミン

300 mg の 4 - シアノベンゾフェノンと 0.37 ml の (R) - 1 - アミノインダンを用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 478 mg 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 1.72-1.88 (1H, m), 2.35-2.53 (1H, m), 2.69 - 2.81 (1H, m), 2.90-3.13 (1H, m), 4.12 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 5.15 (1H, s), 7.19-7.71 (13H, m)。

(61b) N - ((1R) - インダン - 1 - イル) - { フェニル - [4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン

実施例 (6 1 a) の N - ((1 R) - インダン - 1 - イル) - [フェニル - (4 - シアノフェニル) メチル] アミン 4 7 0 m g 、 2 8 3 m g のナトリウムアジドおよび 1 . 1 8 m l のトリ - n - ブチル錫クロライドを用いて、実施例 1 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 3 0 9 m g 得た。

融点 : 2 1 2 °C

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 1.83-2.01 (1H, m), 2.23-2.36 (1H, m), 2.62-2.74 (1H, m), 2.90-3.01 (1H, m), 4.05-4.10 (1H, m), 5.27 (1H, s), 7.19-7.39 (6 H, m), 7.51-7.64 (3H, m), 7.73-7.82 (2H, m), 7.96-8.04 (2H, m) 。

実施例 6 2

N - (4 - カルバモイルフェニルメチル) - { フェニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル } アミン (例示化合物番号 1 - 5 2 1)

(6 2 a) N - (4 - メトキシカルボニルフェニルメチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン

1 g の 3 - シアノベンゾフェノンと 1 . 9 4 g の 4 - アミノメチル安息香酸メチルエステルの塩酸塩を用いて、実施例 (2 a) と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色油状物として 1 . 8 1 g 得た。

NMR スペクトル ($CDCl_3$) δ ppm : 3.79 (2H, s), 3.92 (3H, s), 4.85 (1H, s), 7.17-7.72 (10H, m), 7.77 (1H, s), 7.99-8.02 (2H, m) 。

(6 2 b) N - (4 - カルバモイルフェニルメチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン

実施例 (6 2 a) の N - (4 - メトキシカルボニルフェニルメチル) - [フェニル - (3 - シアノフェニル) メチル] アミン 3 0 0 m g 、 1 . 5 m l のジメチルホルムアミドに溶解させ、0 . 1 m l のホルムアミドと 0 . 1 2 m l の 2 8 % ナトリウムメトキシ/メタノール溶液を室温にて加えた後、8 時間加熱攪拌した。反応液に 2 0 m l の重曹水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、溶媒を留去した。

得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で分離精製し、標記化合物を淡黄色泡状物として216mg得た。

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 3.79 (2H, s), 4.85 (1H, s), 5.60-6.16 (2H, m), 7.29-7.43 (8H, m), 7.52 (1H, d, J=7.8Hz), 7.66 (1H, d, J=7.8Hz), 7.79 (3H, d, J=8.3Hz)。

(62c) N-(4-カルバモイルフェニルメチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン

実施例(62b)のN-(4-カルバモイルフェニルメチル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン210mg、120mgのナトリウムアジド及び0.50mlのトリ-n-ブチル錫クロライドを用いて、実施例1と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色結晶として34mg得た。

融点：144-154℃

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 3.73 (2H, s), 4.96 (1H, s), 7.18-7.62 (8H, m), 7.82-7.91 (4H, m), 8.17 (1H, s)。

参考例1

2-メチルチオ安息香酸-2-ピリジルエステル

5.54gの塩化-2-メチルチオベンゾイルと1.41gの2-ヒドロキシピリジンを12mlのピリジン中、3時間加熱還流した。減圧下、ピリジンを除去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で分離精製し、標記化合物を淡黄色油状物として1.92g得た。

NMRスペクトル(CDCI₃) δ ppm : 2.47 (3H, s), 7.20-8.50 (8H, m)。

参考例2

(2-チエニル)-2-メチルチオフェニルケトン

参考例1で得た2-メチルチオ安息香酸-2-ピリジルエステル680mgと

0.23 ml のチオフェンを 5.0 ml のトリフルオロ酢酸中、2 時間 40 分加熱還流した。反応液を重曹水中に注ぎ中和し、酢酸エチルで抽出した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／ジクロルメタン＝2／1）で分離精製し、標記化合物を淡褐色油状物として 434 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 2.44 (3H, s), 7.10-7.60 (6H, m), 7.73 (1H, d, $J=4.6\text{Hz}$)。

参考例 3

3-メトキシカルボニル安息香酸-2-ピリジルエステル

5.96 g の塩化-3-メトキシカルボニルベンゾイルと 1.43 g の 2-ヒドロキシピリジンを 12.1 ml のピリジン中、3 時間加熱還流した。減圧下でピリジンを留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝2／1）で分離精製し、標記化合物を淡黄色油状物として 2.68 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 3.87 (3H, s), 7.20-8.50 (7H, m), 8.79 (1H, s)。

参考例 4

(2-チエニル)-3-メトキシカルボニルフェニルケトン

参考例 3 で得た 3-メトキシカルボニル安息香酸-2-ピリジルエステル 1.02 g と 0.32 ml のチオフェンを 5.0 ml のトリフルオロ酢酸中、4 時間加熱還流した。反応液を重曹水中に注ぎ中和し、酢酸エチルで抽出した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／ジクロルメタン＝1／2）で分離精製して、標記化合物を淡褐色結晶として、530 mg 得た。

融点：93-95℃

NMR スペクトル (CDCl_3) δ ppm : 3.87 (3H, s), 7.15-7.80 (4H, m), 8.01 (1H, d

, J=7.8Hz), 8.22 (1H, d, J=7.9Hz), 8.48 (1H, s)。

参考例 5

(ベンゾチオフェン-3-イル) - (2-メチルチオフェニル) ケトン

参考例 1 で得た 2-メチルチオ安息香酸-2-ピリジルエステル 556 mg と 456 mg のベンゾチオフェンを 5.0 ml のトリフルオロ酢酸中、3.5 時間加熱還流した。反応液を重曹水中に注ぎ中和し、酢酸エチルで抽出した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン/ジクロルメタン=4/1）で分離精製して、標記化合物を黄色油状物として、397 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 2.44 (3H, s), 7.20-7.95 (8H, m), 8.73 (1H, d, J=7.6Hz) 。

参考例 6

2-エチルチオベンゾフェノン

11.0 g の塩化 2-エチルチオベンゾイルと 7.3 g の塩化アルミニウムを 120 ml の無水ベンゼンに懸濁し、室温で 18 時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を重曹水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン/酢酸エチル=19/1）で分離精製して、標記化合物を黄色油状物として 8.73 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.24 (3H, t, J=7.4Hz), 2.88 (2H, q, J=7.4Hz), 7.20-7.65 (7H, m), 7.79 (2H, d, J=7.2Hz) 。

参考例 7

N, N-ジメチル-2-(4-メチルベンゾイル) ベンズアミド

500 mg の 4-メチルベンゾイル安息香酸を 20 ml の無水テトラヒドロフランに溶解させ、氷冷攪拌下、0.73 ml のトリエチルアミンと 0.3 ml のクロルギ酸イソブチルを加え 1 時間攪拌した。反応液に 204 mg のジメチルア

ミン塩酸塩を加え、室温で2時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝10／1～2／1）で分離精製して、標記化合物を無色油状物として、170mg得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 2.42 (3H, s), 2.90 (3H, s), 2.94 (3H, s), 7.25 (2H, d, J=7.9Hz), 7.35-7.60 (4H, m), 7.71 (2H, d, J=8.2Hz)。

参考例 8

4-メチルチオフェニル-4-ベンゾフェノン

757mgの4-ブロモベンゾフェノンを7.0mlのトルエンと7.0mlのエタノールに溶解させ、室温攪拌下、660mgの4-メチルチオフェニルホウ酸、75mgの20%水酸化パラジウム-炭素および7.0mlの飽和重曹水を加え、窒素気流下、9時間加熱還流した。反応液をセライトを用いて濾過し、酢酸エチルで希釈し、硫酸水素カリウム水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／ジクロルメタン＝4／1）で分離精製して、標記化合物を無色結晶として、312mg得た。

融点：162-164℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 2.54 (3H, s), 7.35 (2H, d, J=8.5Hz), 7.45-7.95 (11H, m)。

参考例 9

3-(2-ベンゾチアゾリルカルボニル)安息香酸メチルエステル

1.10gの塩化-3-メトキシカルボニルベンゾイルと1.15gの2-トリメチルシリルベンゾチアゾールを30mlの無水トルエン中で、20時間加熱還流した。酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲル

ルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝20／1）で分離精製して、標記化合物を無色結晶として、700 mg 得た。

融点：132－135℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 3.99 (3H, s), 7.50-7.75 (3H, m), 8.00-8.80 (4H, m), 9.18 (1H, s)。

参考例 10

4-メチルチオフェニル-2-ベンゾフェノン

1.0 g の 2-ブロモベンゾフェノンを 10 ml のトルエンと 10 ml のエタノールに溶解させ、室温攪拌下、87.0 mg の 4-メチルチオフェニルホウ酸、100 mg の 20% 水酸化パラジウム-炭素および 10 ml の飽和重曹水とを加え、窒素気流下、3.5 時間加熱還流した。反応液をセライトを用いて濾過し、酢酸エチルで希釈し、硫酸水素カリウム水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／ジクロルメタン＝19／1）で分離精製して、標記化合物を淡黄色油状物として 1.36 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 2.40 (3H, s), 7.05-7.70 (13H, m)。

参考例 11

N, N-ジメチル-(2-メトキシ-4-ヒドロキシ-5-ベンゾイル)ベンゼンスルホンアミド

(11a) (2-メトキシ-4-ヒドロキシ-5-ベンゾイル)ベンゼンスルホンクロライド

5.0 g の (2-メトキシ-4-ヒドロキシ-5-ベンゾイル)ベンゼンスルホン酸を 100 ml の無水ジクロルメタンに懸濁し、室温で 13.7 ml の塩化チオニルと 0.06 ml の無水ジメチルホルムアミドを加え 15 分攪拌した。更に、一夜加熱還流し、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をイソプロピルエーテルで処理すると、標記化合物を橙色結晶として 3.58 g 得た。

融点：118-126℃（分解）

(11b) N, N-ジメチル-(2-メトキシ-4-ヒドロキシ-5-ベンゾイル)ベンゼンスルホンアミド

483 mg のジメチルアミン塩酸塩を50 ml の無水テトラヒドロフランに懸濁し、室温攪拌下、1.65 ml のトリエチルアミンを加え15分後、参考例(11a)で得られた1.29 g の(2-メトキシ-4-ヒドロキシ-5-ベンゾイル)ベンゼンスルホンクロライドの10 ml の無水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、15分攪拌した。減圧下、溶媒を留去し、得られた残査を酢酸エチルで希釈し、3規定塩酸水、飽和重曹水、次いで飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝10／1）で分離精製して、標記化合物を無色泡状物として、280 mg 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 2.82 (6H, s), 4.00 (3H, s), 6.61 (1H, s), 7.40-7.75 (5H, m), 8.26 (1H, s), 13.03 (1H, s)。

参考例 12

3-ベンゾイル安息香酸ベンジルエステル

2.262 g の3-ベンゾイル安息香酸を45 ml の無水メチルエチルケトンに溶解し、室温で2.764 g の無水炭酸カリウムと332 mg のヨウ化カリウムと1.44 ml のベンジルクロライドを加え24時間攪拌した。更に、1.382 g の無水炭酸カリウム、166 mg のヨウ化カリウムおよび2.1 ml のベンジルクロライドを加え2時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝6／1）で分離精製して、標記化合物を無色油状物として2.972 g 得た。

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 5.39 (2H, s), 7.30-7.70 (9H, m), 7.80 (2H, d)

, $J=7.0\text{Hz}$), 8.01 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.29 (1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 8.49 (1H, s)。

参考例 13

N-トシル-3-ベンゾイル安息香酸アミド

(13a) カリウム p-トルエンスルホンアミド

856 mg の p-トルエンスルホンアミドと 561 mg の *tert*-ブトキシカリウムを 8.5 ml のメタノールに溶解させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査を酢酸エチルで処理し、標記化合物を無色結晶として 1.025 g 得た。

融点: 245 – 248 °C

(13b) N-トシル-3-ベンゾイル安息香酸アミド

904 mg の 3-ベンゾイル安息香酸を 8.5 ml の無水ジメチルアセトアミドに溶解させ、窒素気流下、氷冷攪拌下、0.61 ml のトリエチルアミンと 0.42 ml のクロルギ酸エチルを加え 1 時間攪拌した。8.5 ml の無水ジメチルアセトアミドを追加した後、参考例 (13a) で得られた 1.004 g のカリウム p-トルエンスルホンアミドを加え、室温下、14 時間攪拌した。反応液を 100 ml の 0.1 規定塩酸水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。水、0.1 規定水酸化ナトリウム、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査を酢酸エチルで処理し、標記化合物を無色結晶として 980 mg 得た。

融点: 127 °C (分解)

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 2.31 (3H, s), 7.17 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.45 – 7.85 (9H, m), 8.16 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.23 (1H, s)。

参考例 14

6-メトキシ-2-メチルチオベンゾフェノン

1.42 g の 6-メトキシ-2-メチルチオベンゼンを 20 ml の *n*-ヘキサンに溶解させ、1.50 ml の N, N, N', N'-テトラメチルエチレンジア

ミンを加えた。氷塩冷却攪拌下、6.2 ml の *n*-ブチルリチウム/*n*-ヘキサン 1.6 モル溶液を滴下し、反応液を室温下 28 時間攪拌した。反応液に、氷塩冷却攪拌下、1.15 ml のベンゾイルクロライドを加え、室温で 3.5 時間攪拌した。重曹水と酢酸エチルを追加し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝50／1～10／1）で分離精製して、標記化合物を無色結晶として 601 mg 得た。

融点：118－119℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 2.37 (3H, s), 3.70 (3H, s), 6.83 (1H, d, *J*=8.3 Hz), 7.02 (1H, d, *J*=8.0 Hz), 7.30-7.90 (6H, m)。

参考例 15

(1-ナフチル) - (2-メチルチオフェニル) ケトン

10.21 g の塩化 2-メチルチオベンゾイルと 3.65 g の塩化アルミニウムを 20 ml の無水ジクロルエタンに懸濁し、3.51 g のナフタレンの 7.0 ml ジクロルエタン溶液を滴下し、室温で 2 日間攪拌した。反応液を氷-希塩酸水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を重曹水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝19／1）で分離精製して、標記化合物を黄色油状物として、2.34 g 得た。

NMR スペクトル (d₆-DMSO) δ ppm : 2.47 (3H, s), 7.05-8.40 (11H, m)。

参考例 16

2-メチルチオフェニルホウ酸

590 mg のマグネシウムを 10 ml の無水テトラヒドロフランに懸濁し、窒素気流下、60℃で 4.70 g の 2-メチルチオブロモベンゼンの 5.0 ml 無

水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、3時間加熱還流した。3.41 mlのトリメトキシホウ素の20 ml無水エーテルに -50°C で上記反応液を滴下し、室温で2時間攪拌し、一夜放置した。氷冷攪拌下、20 mlの飽和重硫酸カリウム水を加え、室温で30分攪拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤シクロヘキサン：酢酸エチル=4/1）で分離精製して、標記化合物を無色結晶として2.03 g得た。

融点： $83-85^{\circ}\text{C}$

NMRスペクトル (CDCl_3) δ ppm : 2.51 (3H, s), 6.40 (2H, s), 7.30-7.60 (3H, m), 8.02 (1H, dd, $J=1.5\text{Hz}$, $J=7.3\text{Hz}$)。

参考例 17

2-メチルチオフェニル-2-ベンゾフェノン

1.0 gの2-ブロモベンゾフェノンと参考例16で得られた870 mgの2-メチルチオフェニルホウ酸を20 mlの水に懸濁し、20 mgの酢酸パラジウムと1.30 gの無水炭酸カリウムと1.40 gのテトラ-n-ブチルアンモニウムブロマイドを加え、 70°C で17時間加熱攪拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、酢酸エチルで希釈した。酢酸エチル層を0.1規定塩酸水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン/酢酸エチル=19/1）で分離精製して、標記化合物を淡黄色油状物として0.99 g得た。

NMRスペクトル (CDCl_3) δ ppm : 2.26 (3H, s), 7.00-7.75 (13H, m)。

参考例 18

2-メチルチオフェニル-4-ベンゾフェノン

1.0 gの4-ブロモベンゾフェノンと参考例16で得られた870 mgの2

ーメチルチオフェニルホウ酸を20mlの水に懸濁し、20mgの酢酸パラジウム、1.30gの無水炭酸カリウムおよび1.40gのテトラ-n-ブチルアンモニウムブロマイドを加え、70℃で3時間加熱攪拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、酢酸エチルで希釈した。酢酸エチル層を0.1規定塩酸水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝19／1）で分離精製して、標記化合物を淡黄色結晶として0.94g得た。

融点：119-121℃

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 2.40(3H, s), 7.20-7.95(13H, m)。

参考例19

N-(2-(2-メチルフェニル)フェニルスルホニル)-3-ベンゾイルベンズアミド

452mgの3-ベンゾイル安息香酸を20mlの無水N、N-ジメチルアセトアミドに溶解し、氷冷攪拌下、0.305mlのトリエチルアミンと0.21mlのクロルギ酸エチルを加え1時間攪拌した。一方、420mgの2-(2-メチルフェニル)ベンゼンスルホンアミドを10mlの無水N、N-ジメチルアセトアミドに溶解し、269mgのt-ブトキシカリウムを加え、室温で45分間攪拌した。両反応液を合わせ、室温で一夜攪拌後、更に、50℃で1時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、希塩酸水、飽和食塩水、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝3／1～1／3）で分離精製して、標記化合物を淡褐色結晶として、253mg得た。

融点：170℃（分解）

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 1.86(3H, s), 6.85-8.15(17H, m)。

参考例 20

(2-ベンゾチアゾリル) - 3-シアノフェニルケトン

1. 0 g の 3-シアノベンゾイルクロライドと 1. 25 g の 2-トリメチルシリルベンゾチアゾールを用いて、参考例 9 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を黄色結晶として 530 mg 得た。

融点：144 - 145℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 7.55-8.80 (7H, m), 9.02 (1H, s)。

参考例 21

N - (1-エチルペンチル) - [フェニル - (3-カルボキシフェニル) メチル] アミン - シュウ酸塩

(21a) N - (1-エチルペンチル) - [フェニル - (3-メトキシカルボニルフェニル) メチル] アミン

2. 337 g のメチル 3-ベンゾイルベンゾエートと 2. 952 g の 1-エチルペンチルアミン塩酸塩を 46 ml の無水ジクロルメタンに溶解させ、窒素気流下、氷冷攪拌下、6. 75 ml のトリエチルアミンと 9. 70 ml の四塩化チタン - ジクロルメタンの 1 モル溶液を加え、反応液を室温で 17 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、0. 5 規定塩酸水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査を 56 ml のメタノールに溶解させ、0. 74 ml の酢酸と 2. 162 g のナトリウムシアノボロヒドリドを加え、1 時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤：シクロヘキサン/酢酸エチル = 9/1) で分離精製し、目的物を無色油状物として 2. 584 g 得た。得られた無色油状物 136 mg とシュウ酸 36 mg とから、標記目的化合物であるシュウ酸塩を 114 mg 得た。

融点：70 - 78℃

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.84 (6H, t, $J=6.7$ Hz), 1.10-1.30 (4H, m), 1.40-1.75 (4H, m), 2.55-2.68 (1H, m), 3.86 (3H, s), 5.58 (1H, s), 7.28-7.70 (6H, m), 7.90 (2H, d, $J=7.6$ Hz), 8.24 (1H, s)。

(21b) N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-カルボキシフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

参考例(21a)で得られた168mgのN-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-メトキシカルボニルフェニル)メチル]アミンを8.1mlのテトラヒドロフランに溶解させ、氷冷攪拌下、448mgのポタシウム *tert*-ブトキシドと18 μ lの水を加え、反応液を室温で3時間攪拌した。反応液に4.0mlの1規定塩酸水を加え、減圧下、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:メタノール/酢酸エチル=1/1~5/1)で分離精製し、標記化合物を油状物として84mg得た。

融点: 195-197 $^{\circ}$ C

NMR スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.70-0.90 (6H, m), 1.10-1.70 (6H, m), 2.50-2.65 (1H, m), 5.40-5.55 (1H, br. s), 7.25-7.65 (6H, m), 7.75-7.90 (2H, m), 8.20 (1H, s)。

参考例 22

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-N,N-ジメチルカルバモイルフェニル)メチル]アミン

1.383gのN,N-ジメチル-3-ベンゾイルベンゾエートと1.656gの1-エチルペンチルアミン塩酸塩を28mlの無水ジクロロメタンに溶解させ、窒素気流下、氷冷攪拌下、3.80mlのトリエチルアミンと5.50mlの四塩化チタン-ジクロロメタンの1モル溶液を加え、反応液を室温で23時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、0.5規定塩酸水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣を38mlのメタノールに溶解させ、0.47mlの酢酸と1.372g

のナトリウムシアノボロヒドリドを加え、1時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で分離精製し、目的物を無色油状物として1.314 g得た。

NMRスペクトル(CDCl₃) δ ppm : 0.75-0.95(6H, m), 1.10-1.65(9H, m), 2.30-2.45(1H, m), 2.92(3H, s), 3.09(3H, s), 4.96(1H, s), 7.10-7.50(9H, m)。

参考例 23

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-カルバモイルフェニル)メチル]アミンシュウ酸塩

参考例21で得られた0.626 gのN-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-カルボキシフェニル)-メチル]アミン塩酸塩を12.4 mlの無水ジメチルホルムアミドに溶解させ、氷冷撹拌下、0.46 mlのトリエチルアミンと0.19 mlのクロルギ酸エチルを加え、反応液を室温で1時間撹拌した後、0.56 mlの28%アンモニア水を加え、室温で30分間撹拌した。食塩水に反応液を加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で分離精製し、フリー体を無色結晶として0.354 g得た。フリー体0.111 gを用いて、標記化合物をシュウ酸塩として87 mg得た。

融点：169-173℃

NMRスペクトル(d₆-DMSO) δ ppm : 0.84(6H, t, J=7.4Hz), 1.10-1.30(4H, m), 1.40-1.70(4H, m), 2.50-2.65(1H, m), 5.46(1H, br. s), 7.20-8.20(11H, m)。

参考例 24

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-シアノフェニル)メチル]アミン塩酸塩

参考例 2 3 で得られた 2 2 7 m g の N - (1 - エチルペンチル) - [フェニル - (3 - カルバモイルフェニル) - メチル] アミンを 4 6 m l の無水ジクロルメタンに溶解させ、氷冷撹拌下、0 . 1 0 m l のオキシ塩化リンを加え、反応液を室温で 1 時間撹拌後、0 . 1 0 m l のオキシ塩化リンを加え、1 時間撹拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：シクロヘキサン／酢酸エチル = 9 / 1 ）で分離精製し、無色の油状物 2 0 1 m g を得た。得られた油状物 6 3 m g から、標記化合物を塩酸塩として 6 3 m g 得た。

融点：1 5 1 - 1 5 5 °C

N M R スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.75-0.95 (6H, m), 1.10-1.35 (4H, m), 1.55-1.95 (4H, m), 2.70-2.90 (1H, m), 5.79 (1H, br. s), 7.35-8.20 (8H, m), 8.34 (1H, s), 9.68 (2H, br. s)。

参考例 2 5

N - シクロヘキシル - [フェニル - (3 - ヒドロキシメチルフェニル) メチル] アミンシュウ酸塩

参考例 2 6 で得られた 3 2 3 m g の N - シクロヘキシル - [フェニル - (3 - メトキシカルボニルフェニル) メチル] アミンと 1 . 0 m l の水素化リチウムアルミニウム - 無水テトラヒドロフラン 1 モル溶液を用いて、実施例 2 4 と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色結晶として 3 0 7 m g 得た。

融点：1 8 0 - 1 8 2 °C

N M R スペクトル (d_6 -DMSO) δ ppm : 0.90-1.80 (8H, m), 2.05-2.22 (2H, m), 2.60-2.75 (1H, m), 4.50 (2H, s), 5.62 (1H, s), 7.20-7.80 (9H, m)。

参考例 2 6

N - シクロヘキシル - [フェニル - (3 - メトキシカルボニルフェニル) メチル] アミン

2. 138 g のメチル 3-ベンゾイルベンゾエートと2. 04 ml のシクロヘキシルアミンを用いて、実施例(2a)と同様に反応させ、精製して、標記化合物を無色油状物として2. 653 g 得た。

融点: 180-182℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 1.00-1.80 (9H, m), 1.85-2.05 (2H, m), 2.30-2.45 (1H, m), 3.90 (3H, s), 5.08 (1H, s), 7.15-7.45 (6H, m), 7.61 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.88 (1H, d, J=7.8 Hz), 8.07 (1H, s)。

参考例 27

3-ベンゾイル-4-フルオロベンゾニトリル

1. 0 g の3-ブロモ-4-フルオロベンゾニトリル及び0. 58 ml のベンゾイルクロライドの20 ml 無水テトラヒドロフラン溶液に、3. 1 ml の1. 6 M n-ブチルリチウムn-ヘキサン溶液を窒素雰囲気下、-65~-66℃で滴下して加えた。更に-70℃で1時間攪拌した後、反応液に20 ml の氷を加え、0℃に昇温させた。反応液を100 ml の酢酸エチルで希釈し、水層を分離した後、有機層をクエン酸水、飽和食塩水、飽和重曹水、及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤: シクロヘキサン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、標記化合物を白色粉末として450 mg 得た。

融点: 90-92℃

NMR スペクトル (CDCl₃) δ ppm : 7.32 (1H, dd, J=8.6 Hz, J=8.8 Hz), 7.52 (2H, m), 7.61 (1H, m), 7.79-7.89 (4H, m)。

参考例 28

2, 4-ジメトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルベンゾフェノン

68. 3 mg の水素化ナトリウムの10 ml 無水ジメチルホルムアミド懸濁液に500 mg の2-ヒドロキシ-4-メトキシ-5-N, N-ジメチルスルファモイルベンゾフェノンの10 ml の無水ジメチルホルムアミド溶液を、窒素雰囲気

気下、3-4℃で滴下して加え、室温で30分間攪拌した。反応液を再度冷却し、沃化メチルを滴下して加え、室温で15時間攪拌した。反応液を150mlの酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水、飽和食塩水、3N-塩酸、飽和食塩水、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水、飽和重曹水、次いで飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下、溶媒を留去した。得られた残渣をジイソピロピルエーテルを用いて粉末化し、標記化合物を淡黄色粉末として410mg得た。

融点：148-150℃

NMRスペクトル(CDC1₃) δ ppm : 2.84 (6H, s), 3.83 (3H, s), 4.02 (3H, s), 6.56 (1H, s), 7.44 (2H, dd, J=7.3Hz, J=7.9Hz), 7.57 (1H, t, J=7.2Hz), 7.76 (2H, dd, J=1.7Hz, J=8.5Hz), 7.96 (1H, s)。

試験例 1

Caco-2細胞を用いた回腸型胆汁酸トランスポーター阻害活性の測定

本試験例における回腸型胆汁酸トランスポーター阻害活性の測定は、

[J. Biol. Chem., 269, 1340-1347 (1994)] に記載されているWongらの方法に準じて行われた。

即ち、胆汁酸トランスポーターの発現細胞として[Am. J. Physiol., 264, G1118-G1125 (1993)] に記載されているCaco-2細胞を用いた。

コラゲンコートした96ウェル培養プレート(商品名:ピュープレート、パッカー社製)の各ウェルに 4×10^4 / mlのCaco-2細胞を200μlずつまいた後、15日間以上培地を適宜交換して培養した。本培養系に検体(実施例1、11および15の化合物)を添加した後、0.1μCiの放射性タウロコール酸([³H]-taurocholic acid: NEN社製)を加え、5%CO₂の存在下37℃で1時間インキュベートし、放射性タウロコール酸を回腸型胆汁酸トランスポーターによってCaco-2細胞に取り込ませた。Caco-2細胞を、氷冷した0.2%牛血清アルブミン(bovine serum albumin)、1mMタウロコ

ール酸 (cold) を含む P B S (phosphate buffered saline) で 5 回洗浄した後一晩放置し乾燥させた。9 6 ウェル培養プレート of 各ウェルに 2 5 0 μ l ずつ液体シンチレーションカクテル (商品名: Microscint20、パッカード社製) を加え、液体シンチレーションカウンターの一種であるトップカウント (パッカード社製) により、放射活性を測定した。試験化合物を用いず to 求めたコントロール of 放射活性と一定濃度の試験化合物を用いた時の放射活性から阻害率 (%) を求め、回腸型胆汁酸トランスポーター活性を 5 0 % 阻害する試験化合物 of 濃度を調べた。その結果を表 4 に示す。

【表 4】

実施例化合物番号	I C ₅₀ (μ g / m l)
3 2 (異性体 A)	1 . 2
3 2 (異性体 B)	0 . 8
3 7	2 . 9
4 2 (異性体 B)	2 . 1
5 1 (異性体 B)	1 . 3

試験例 2

ラット反転腸管リング (rat everted ileal rings) を用いた回腸型胆汁酸トランスポーター阻害活性 of 測定

本試験例における of 回腸型胆汁酸トランスポーター阻害活性 of 測定は、
[Pharm. Res., 12, 693-699 (1995)] に記載されている S t e w a r t ら of 方法に準じて行われた。

即ち、胆汁酸トランスポーター of 材料としてラット反転腸管リングを用いた。

6～10週令のウィスターイマミチ系雄性ラットをエーテルにより麻酔し、回腸部分を盲端部より約20cm摘出し反転させた後、氷冷リンゲル緩衝液中で盲端部より順に5mmずつカットし24個のラット反転腸管リングを得た。回腸の部位による胆汁酸トランスポーターの発現量の違いを是正するため、リングを回腸の上下により適当に選び出し、4個で1群として計6群のグループとした。各リングを1mlの放射性タウロコール酸溶液中、37℃で3分間、90rpmの速度で振盪しながら、回腸型胆汁酸トランスポーターによりリングに放射性タウロコール酸を取り込ませた。放射性タウロコール酸溶液の組成は、1.0μCi放射性タウロコール酸、0.037mMタウロコール酸(cold)、適当濃度の各種検体およびリンゲル緩衝液から成る。リングをリンゲル緩衝液により3回洗浄した後、湿重量を測定し、バイアル瓶に入れ、組織溶解剤NCS-II(AMERSHAM社製)を0.5ml添加し、50℃で一晩放置して完全に溶解させた。2.5mlの液体シンチレーションカクテルを添加し、液体シンチレーションカウンタ(scintillation counter)で放射活性を測定した。

回腸型胆汁酸トランスポーター活性は、各放射性活性を湿重量で補正し、dpm/mg(1mg当たりの放射活性)で表した後、各群の平均値をその活性とし、試験化合物の濃度を100μg/mlとした時の回腸型胆汁酸トランスポーター活性の阻害率を求めた。その結果を表5に示す。

【表5】

実施例化合物番号	阻害率(%)
1	72
42(異性体B)	77

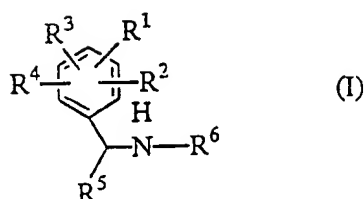
製剤例 1

錠剤

実施例 1 の化合物	1 0	m g
乳糖	6 8 . 5	
結晶セルロース	2 0	
カルボキシメチルスターチ ナトリウム	5	
軽質無水ケイ酸	0 . 5	
ステアリン酸 マグネシウム	1	
	<hr/>	
	1 0 5	m g

請求の範囲

1. 一般式



[式中、 R^1 は、置換基群 α から選択される基で 1 乃至 3 個置換された $C_0 - C_{10}$ アリール基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、($C_3 - C_6$ シクロアルキル) カルバモイル基、($C_1 - C_6$ アルキル) スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_0 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_0 - C_{10}$ アリールスルホニル基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、ジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい ($C_0 - C_{10}$ アリール) スルホニルカルバモイルアミノ基を示し、

R^2 、 R^3 および R^4 は、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基またはジー ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ基を示し、

R^5 は、置換基群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよい $C_0 - C$

10. アリール基または置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル若しくはオキサゾリル基を示し、

R^6 は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基、式 $-W-R^7$ [式中、 W は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^7 は、置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_3 - C_6$ シクロアルキル基を示す。] を有する基または置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_7 - C_{10}$ アラルキル基を示す。

但し、 R^1 が、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基または $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基を示す場合、 R^6 は $C_1 - C_{10}$ アルキル基以外の基を示す。]

を有するベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 α >

置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基

<置換基群 β >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基およびハロゲン原子

<置換基群 γ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および式 $-Z-R^8$ [式中、 Z は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^8 は、カルボキシ基、 $C_2 - C_7$ アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、モノー ($C_1 - C_6$ アルキル)カルバモイル基、ジー ($C_1 - C_6$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基または水酸基を示す。] を有する基

<置換基群 δ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および置換基

群 β から選択される基で 1 乃至 3 個置換されてもよいフェニル基。

2. 請求の範囲第 1 項において、 R^1 が、置換基群 α 1 から選択される基で置換されたフェニル基、置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、($C_6 - C_6$ シクロアルキル)カルバモイル基、($C_1 - C_4$ アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 α 1>

置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基および置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基

<置換基群 β 1>

$C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 2>

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 1>

$C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロゲン原子および置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニル基。

3. 請求の範囲第 1 項において、 R^1 が、2-, 3-若しくは 4- (1H-テ

トラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メチルテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メトキシテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-プロピルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-ブチルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルアミノフェニル基、2-, 3-若しくは4-フェニルスルホニルアミノフェニル基、置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C₁-C₂アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、C₁-C₂アルキルスルフィニル基、置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 β 2>

C₁-C₂アルキル基、C₁-C₂アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 2>

C₁-C₂アルキル基、C₁-C₂アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいフェニル基。

4. 請求の範囲第1項において、R¹が、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニル

フェニル基、2-、3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 δ 3から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基または置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基（該置換基は、 C_1 - C_2 アルキル、メトキシ、弗素または塩素）であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 β 2>

C_1 - C_2 アルキル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子および C_1 - C_2 アルキル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されてもよいフェニル基。

5. 請求の範囲第1項において、 R^1 が、2-メチルスルホニルフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 δ 4から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ブチルスルホニル基、フェニルスルホニル基またはメチルで置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 4>

メチル基、フェニル基およびメチルフェニル基。

6. 請求の範囲第1項において、 R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基またはトシルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

7. 請求の範囲第1項において、 R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

8. 請求の範囲第1項乃至第7項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、水酸基、弗素原子、塩素原子、アミノ基、モノー ($C_1 - C_2$ アルキル) アミノ基またはジー ($C_1 - C_2$ アルキル) アミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

9. 請求の範囲第1項乃至第7項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、水酸基、弗素原子または塩素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

10. 請求の範囲第1項乃至第7項より選択されるいずれか1項において、 R^2 が水素原子、メトキシ基または弗素原子であり、 R^3 および R^4 が水素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

11. 請求の範囲第1項乃至第7項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、水素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

12. 請求の範囲第1項乃至第11項より選択されるいずれか1項において、 R^5 が、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、ナフチル、チエニル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル、ベンゾチエニル、1,1-ジオキソベンゾチエニルまたはベンゾチアゾリル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 $\beta 1$ >

C₁ - C₄ アルキル基、C₁ - C₄ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子。

13. 請求の範囲第1項乃至第11項において、R⁶ が、置換基群β2から選択される基で置換されてもよい、フェニル、チエニル、チアゾリル、ベンゾチエニルまたは1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群β2>

C₁ - C₂ アルキル基、C₁ - C₂ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子。

14. 請求の範囲第1項乃至第11項より選択されるいずれか1項において、R⁶ が、置換基群β3から選択される基で置換されてもよいフェニル基、ベンゾチエニル基または1, 1-ジオキソベンゾチエニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群β3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子。

15. 請求の範囲第1項乃至第11項より選択されるいずれか1項において、R⁶ が、フェニル、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニルまたは3, 4, 5-トリメトキシフェニルまたは1, 1-ジオキソベンゾチオフェン-3-イル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

16. 請求の範囲第1項乃至第11項より選択されるいずれか1項において、R⁶ が、フェニルまたは2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

17. 請求の範囲第1項乃至第11項より選択されるいずれか1項において、R⁶ が、フェニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

18. 請求の範囲第1項乃至第17項より選択されるいずれか1項において、R⁶ が、C₃ - C₈ アルキレン基、式-W-R⁷ [式中、Wは、単結合またはC

$\gamma 1$ - C_2 アルキレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい C_5 - C_6 シクロアルキル基である。] を有する基または置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基（アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が C_1 - C_4 アルキル基である。）であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 $\gamma 1$ >

C_1 - C_2 アルキル基、 t -ブチル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および式 $-Z-R^8$ [式中、 Z は、単結合または C_1 - C_2 アルキレン基であり、 R^8 は、カルボキシ、 C_2 - C_3 アルコキシカルボニル、カルバモイル、モノ- (C_1 - C_2 アルキル) カルバモイル、ジ- (C_1 - C_2 アルキル) カルバモイル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニルまたは水酸基] を有する基。

19. 請求の範囲第1項乃至第17項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、 C_3 - C_8 アルキレン基、式 $-W-R^7$ を有する基 [式中、 W は、単結合またはメチレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい C_5 - C_6 シクロアルキル基である。] または置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基（アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が C_1 - C_4 アルキル基である。）であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 $\gamma 2$ >

メチル基、 t -ブチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、ジメチルカルバモイル基およびヒドロキシメチル基。

20. 請求の範囲第1項乃至第17項において、 R^6 が、イソプロピル基、ブチル基、 t -ブチル基、ネオペンチル基、1-エチルペンチル基、2-エチルヘキシル基または置換基群 $\gamma 3$ から選択される基で置換されてもよい、シクロヘキシル、ベンジル、1-フェニルエチル若しくは2-フェニルエチル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

<置換基群 γ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子。

21. 請求の範囲第1項乃至第17項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、1-エチルペンチル基、シクロヘキシル基または1-フェニルエチル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

22. 請求の範囲第1項乃至第17項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、1-エチルペンチル基または1-フェニルエチル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

23. N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[6-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{(4-メトキシフェニル)-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-メチルスルホニルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-シクロヘキシル-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - [フェニル - (3 - N - トシルカルバモイルフェニル) メチル] アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [3 - (2 - (2 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [3 - (2 - (3 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [3 - (2 - (4 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (2 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (4 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (インダン - 1 - イル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - (2 - フェニルエチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - tert - ブチル - [フェニル - (2 - フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - {2 - [1 - フェニル - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

N - {2 - [1 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

N - (1 - エチルペンチル) - {2 - インデニル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インデニル - [4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - エチルベンチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { (1, 1 - ジオキソチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - エチルベンチル) - {2 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {3 - チアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - インドリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - シクロヘキシル - [(1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 3 - イル) - (2 - メチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

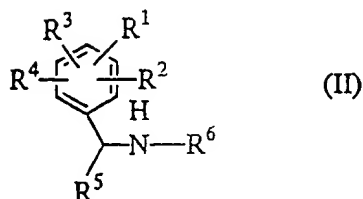
N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { (1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - ベンゾチアゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン若しくは

N - (1 - フェニルエチル) - {3 - ベンゾオキサゾリル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン

であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩。

24. 一般式



[式中、 R^1 は、置換基群 α から選択される基で1乃至3個置換された $C_6 - C_{10}$ アリール基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、 $(C_3 - C_6$ シクロアルキル)カルバモイル基、 $(C_1 - C_6$ アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $(C_6 - C_{10}$ アリール)スルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニル基、モノー $(C_1 - C_6$ アルキル)アミノスルホニル基、ジー $(C_1 - C_6$ アルキル)アミノスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_7 - C_{11}$ アリールカルボニルアミノ基、置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $(C_6 - C_{10}$ アリール)スルホニルカルバモイルアミノ基を示し、

R^2 、 R^3 および R^4 は、同一または異なって、水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子、アミノ基、モノー $(C_1 - C_6$ アルキル)アミノ基またはジー $(C_1 - C_6$ アルキル)アミノ基を示し、

R^5 は、置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリール基または置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよく

ベンゼン環と縮合してもよい、チエニル、ピロリル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル若しくはオキサゾリル基を示し、

R^6 は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル基、式 $-W-R^7$ [式中、 W は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^7 は、置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_3 - C_6$ シクロアルキル基を示す。]を有する基または置換基群 γ から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_7 - C_{10}$ アラルキル基を示す。]

を有するベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 α >

置換基群 β から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよい $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニルアミノ基

<置換基群 β >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基およびハロゲン原子

<置換基群 γ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および式 $-Z-R^8$ [式中、 Z は、単結合または $C_1 - C_6$ アルキレン基を示し、 R^8 は、カルボキシ基、 $C_2 - C_7$ アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、モノー($C_1 - C_6$ アルキル)カルバモイル基、ジー($C_1 - C_6$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基または水酸基を示す。]を有する基

<置換基群 δ >

$C_1 - C_6$ アルキル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、ハロゲン原子および置換基群 β から選択される基で1乃至3個置換されてもよいフェニル基。

25. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、置換基群 α 1から選択される基

で置換されたフェニル基、置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、 $(C_0 - C_0$ シクロアルキル)カルバモイル基、 $(C_1 - C_4$ アルキル)スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、スルホ基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル基、置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよい、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 α 1>

置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、スルホ基、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基および置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルアミノ基

<置換基群 β 1>

$C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 2>

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 1>

$C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ハロゲン原子および置換基群 β 1 から選択される基で置換されてもよいフェニル基。

26. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、2-, 3-若しくは4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メチル

テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-メトキシ
 テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-フルオロ
 テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-(1-クロロテ
 トラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニル
 フェニル基、2-, 3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、2-, 3-
 若しくは4-プロピルスルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-ブチルス
 ルホニルフェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホニルアミノフェニル
 基、2-, 3-若しくは4-フェニルスルホニルアミノフェニル基、置換基群 β
 2 から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、(C_1 - C_2 アルキル
) スルホニルカルバモイル基、置換基群 δ 2 から選択される基で置換されてもよ
 いフェニルスルホニルカルバモイル基、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル基、置換
 基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基、 C_1 - C
 $_2$ アルキルスルフィニル基、置換基群 β 3 から選択される基で置換されてもよい
 、フェニルカルボニルアミノ若しくはテトラゾリルカルボニルアミノ基または置
 換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイ
 ルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分と
 して含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 β 2>

C_1 - C_2 アルキル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 2>

C_1 - C_2 アルキル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および
 置換基群 β 2 から選択される基で置換されてもよいフェニル基。

27. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、2-, 3-若しくは4-(1H
 -テトラゾール-5-イル) フェニル基、2-, 3-若しくは4-メチルスルホ

ニルフェニル基、2-、3-若しくは4-エチルスルホニルフェニル基、置換基群 β 2から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 δ 3から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニル基または置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基（該置換基は、 C_1 - C_2 アルキル、メトキシ、弗素または塩素）であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 β 2>

C_1 - C_2 アルキル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子および C_1 - C_2 アルキル、メトキシ、弗素若しくは塩素で置換されてもよいフェニル基。

28. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、2-メチルスルホニルフェニル基、3-メチルスルホニルフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、置換基群 β 3から選択される基で置換されてもよいテトラゾリル基、置換基群 δ 4から選択される基で置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ブチルスルホニル基、フェニルスルホニル基またはメチルで置換されてもよいフェニルスルホニルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 β 3>

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子

<置換基群 δ 4>

メチル基、フェニル基およびメチルフェニル基。

29. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基またはトシルカルバモイルアミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

30. 請求の範囲第24項において、 R^1 が、1H-テトラゾール-5-イル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

31. 請求の範囲第24項乃至第30項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、 C_1 - C_2 アルキル基、 C_1 - C_2 アルコキシ基、水酸基、弗素原子、塩素原子、アミノ基、モノ- (C_1 - C_2 アルキル) アミノ基またはジ- (C_1 - C_2 アルキル) アミノ基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

32. 請求の範囲第24項乃至第30項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、同一または異なって、水素原子、メチル基、メトキシ基、水酸基、弗素原子または塩素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

33. 請求の範囲第24項乃至第30項より選択されるいずれか1項において、 R^2 が水素原子、メトキシ基または弗素原子であり、 R^3 および R^4 が水素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

34. 請求の範囲第24項乃至第30項より選択されるいずれか1項において、 R^2 、 R^3 および R^4 が、水素原子であるベンジルアミン類またはその薬理上

許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

35. 請求の範囲第24項乃至第34項より選択されるいずれか1項において、 R^5 が、置換基群 $\beta 1$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、ナフチル、チエニル、1,1-ジオキソチエニル、チアゾリル、ベンゾチエニル、1,1-ジオキソベンゾチエニルまたはベンゾチアゾリル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\beta 1$ >

$C_1 - C_4$ アルキル基、 $C_1 - C_4$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子。

36. 請求の範囲第24項乃至第34項において、 R^5 が、置換基群 $\beta 2$ から選択される基で置換されてもよい、フェニル、チエニル、チアゾリル、ベンゾチエニルまたは1,1-ジオキソベンゾチエニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\beta 2$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子および塩素原子。

37. 請求の範囲第24項乃至第34項より選択されるいずれか1項において、 R^5 が、置換基群 $\beta 3$ から選択される基で置換されてもよいフェニル基、ベンゾチエニル基または1,1-ジオキソベンゾチエニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\beta 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子。

38. 請求の範囲第24項乃至第34項より選択されるいずれか1項において、 R^5 が、フェニル、2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル、2, 3-ジメ

トキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニルまたは3, 4, 5-トリメトキシフェニルまたは1, 1-ジオキソベンゾチオフェン-3-イル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

39. 請求の範囲第24項乃至第34項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、フェニルまたは2-, 3-若しくは4-メトキシフェニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

40. 請求の範囲第24項乃至第34項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、フェニル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

41. 請求の範囲第24項乃至第40項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、 $C_3 - C_8$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ [式中、Wは、単結合または $C_1 - C_2$ アルキレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_6 - C_{10}$ シクロアルキル基である。] を有する基または置換基群 $\gamma 1$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基（アリアル部分がフェニル基でありアルキル部分が $C_1 - C_4$ アルキル基である。）であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\gamma 1$ >

$C_1 - C_2$ アルキル基、t-ブチル基、 $C_1 - C_2$ アルコキシ基、弗素原子、塩素原子および式 $-Z-R^8$ [式中、Zは、単結合または $C_1 - C_2$ アルキレン基であり、 R^8 は、カルボキシ、 $C_2 - C_3$ アルコキシカルボニル、カルバモイル、モノ- ($C_1 - C_2$ アルキル) カルバモイル、ジ- ($C_1 - C_2$ アルキル)

カルバモイル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニルまたは水酸基]を有する基。

42. 請求の範囲第24項乃至第40項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、 $C_3 - C_6$ アルキレン基、式 $-W-R^7$ を有する基[式中、Wは、単結合またはメチレン基であり、 R^7 は、置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよくベンゼン環と縮合してもよい $C_5 - C_6$ シクロアルキル基である。]または置換基群 $\gamma 2$ から選択される基で置換されてもよいアラルキル基(アリール部分がフェニル基でありアルキル部分が $C_1 - C_4$ アルキル基である。)であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\gamma 2$ >

メチル基、*t*-ブチル基、メトキシ基、弗素原子、塩素原子、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、ジメチルカルバモイル基およびヒドロキシメチル基。

43. 請求の範囲第24項乃至第40項において、 R^6 が、イソプロピル基、ブチル基、*t*-ブチル基、ネオペンチル基、1-エチルペンチル基、2-エチルヘキシル基または置換基群 $\gamma 3$ から選択される基で置換されてもよい、シクロヘキシル、ベンジル、1-フェニルエチル若しくは2-フェニルエチル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

<置換基群 $\gamma 3$ >

メチル基、メトキシ基、弗素原子および塩素原子。

44. 請求の範囲第24項乃至第40項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、1-エチルペンチル基、シクロヘキシル基または1-フェニルエチル基であるベンジルアミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

45. 請求の範囲第24項乃至第40項より選択されるいずれか1項において、 R^6 が、1-エチルペンチル基または1-フェニルエチル基であるベンジルア

ミン類またはその薬理上許容される塩を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

46. N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[6-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-エチルペンチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{(4-メトキシフェニル)-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-メチルスルホニルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-(1-エチルペンチル)-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-シクロヘキシル-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-(1-フェニルエチル)-[フェニル-(3-N-トシルカルバモイルフェニル)メチル]アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(2-(2-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

N-(1-フェニルエチル)-{フェニル-[3-(2-(3-メチルフェニル)フェニル)スルホニルカルバモイルフェニル]メチル}アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [3 - (2 - (4 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (2 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {フェニル - [4 - (2 - (4 - メチルフェニル) フェニル) スルホニルカルバモイルフェニル] メチル} アミン、

N - (1 - エチルペンチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - (インダン - 1 - イル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - (2 - フェニルエチル) - [フェニル - (2 - エチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - t e r t - ブチル - [フェニル - (2 - フェニルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - {2 - [1 - フェニル - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

N - {2 - [1 - (4 - メトキシフェニル) - 1 - (N - 1 - フェニルエチル) アミノ] メチル} フェニル - N' - トシルウレア、

N - (1 - エチルペンチル) - {2 - インデニル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インデニル - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - エチルペンチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {1 - ナフチル - [4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { (1, 1 - ジオキシチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - エチルペンチル) - {2 - チアゾリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {3 - チアゾリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - (1 - フェニルエチル) - {2 - インドリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - インドリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - シクロヘキシル - [(1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 3 - イル) - (2 - メチルスルホニルフェニル) メチル] アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - { (1, 1 - ジオキシベンゾチオフェン - 2 - イル) - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン、

N - [1 - (4 - ブロモフェニル) エチル] - {2 - ベンゾチアゾリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミンまたは

N - (1 - フェニルエチル) - {3 - ベンゾオキサゾリル - [3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] メチル} アミン

を有効成分として含有する回腸型胆汁酸トランスポーター活性を阻害するための組成物。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP98/02531

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁶ C07C237/38, 309/45, 311/08, 311/21, 317/32, C07D257/04, 333/20, 417/10, A61K31/135, 31/17, A61K31/27, 31/38, 31/41, 31/425, 31/475

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁶ C07C237/38, 309/45, 311/08, 311/21, 317/32, C07D257/04, 333/20, 417/10, A61K31/135, 31/17, A61K31/27, 31/38, 31/41, 31/425, 31/475

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 2-49771, A (Mitsubishi Kasei Corp.), 20 February, 1990 (20. 02. 90) (Family: none)	1-23
A	JP, 9-20775, A (Bayer AG.), 21 January, 1997 (21. 01. 97) & EP, 753517, A1 & DE, 19525028, A1	1-46
A	WO, 95/18121, A1 (Yamanouchi Pharmaceutical Co., Ltd.), 6 July, 1995 (06. 07. 95) & AU, 9512799, A	1-46
A	JP, 7-233128, A (Kaken Pharmaceutical Co., Ltd.), 5 September, 1995 (05. 09. 95) (Family: none)	1-46

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 25 August, 1998 (25. 08. 98)	Date of mailing of the international search report 1 September, 1998 (01. 09. 98)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/02531

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁸ C07C237/38, 309/45, 311/08, 311/21, 317/32,
C07D257/04, 333/20, 417/10, A61K31/135, 31/17,
A61K31/27, 31/38, 31/41, 31/425, 31/475

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁸ C07C237/38, 309/45, 311/08, 311/21, 317/32,
C07D257/04, 333/20, 417/10, A61K31/135, 31/17,
A61K31/27, 31/38, 31/41, 31/425, 31/475

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP, 2-49771, A (三菱化成株式会社), 20. 2月. 1 990 (20. 02. 90) (ファミリーなし)	1-23
A	JP, 9-20775, A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフ ト), 21. 1月. 1997 (21. 01. 97) &EP, 753517, A1&DE, 19525028, A1	1-46
A	WO, 95/18121, A1 (山之内製薬株式会社), 6. 7 月. 1995 (06. 07. 95) &AU, 9512799, A	1-46
A	JP, 7-233128, A (科研製薬株式会社), 5. 9月. 1 995 (05. 09. 95) (ファミリーなし)	1-46

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

25. 08. 98

国際調査報告の発送日

01.09.98

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

西川 和子

印

4H

7419

電話番号 03-3581-1101 内線 3444